



① BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENTAMT

⑫ **Offenlegungsschrift**
⑩ **DE 40 29 650 A 1**

⑳ Aktenzeichen: P 40 29 650.4
㉑ Anmeldetag: 19. 9. 90
㉒ Offenlegungstag: 26. 3. 92

⑤ Int. Cl.⁵:
C 07 D 239/46
C 07 D 239/70
C 07 D 239/84
C 07 D 239/86
C 07 D 401/12
C 07 D 403/12
C 07 D 405/12
C 07 D 413/12
C 07 D 417/12
C 07 D 491/048
C 07 D 495/04
A 01 N 43/54

DE 40 29 650 A 1

// C07D 521/00 (C07D 491/048,239:00,307:00) (C07D 495/04,239:00,333:00,335:00) (C07D 239/46,213:04,209:04,215:58,279:16,265:36,309:02,333:04)C09D 5/14,C10M 133/40,C10N 30:16 (A01N 43/54,57:00,47:10,55:04,53:00,37:52)

㉓ Anmelder:
Hoechst AG, 6230 Frankfurt, DE

㉔ Erfinder:
Minn, Klemens, Dr., 6234 Hattersheim, DE; Braun,
Peter, Dr., 6500 Mainz, DE; Sachse, Burkhard, Dr.,
6233 Kelkheim, DE; Wicke, Heinrich, Dr., 6239
Eppstein, DE

⑤ 2-Anilino-pyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltene Mittel und ihre Verwendung als Fungizide

DE 40 29 650 A 1

Beschreibung

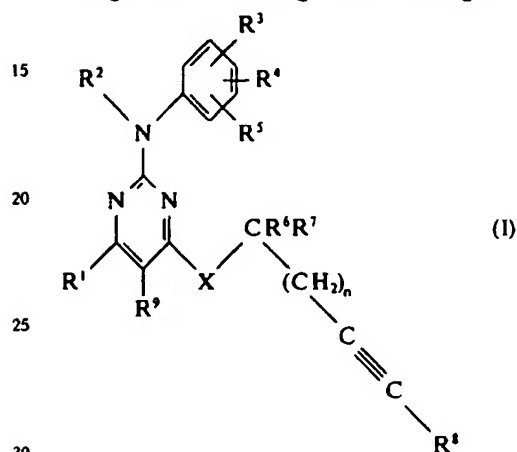
2-Anilino-pyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltene Mittel und ihre Verwendung als Fungizide.

2-Anilino-pyrimidin-Derivate sind bekannt als wirksame Komponenten in fungiziden Mitteln (vergl. GB 12 45 085, DD 1 51 404, DD 2 36 667, EP 2 34 136, EP 2 24 339, EP 2 70 111, JP 61/015 877, EP 1 35 472, AU 85/43988, EP 2 95 210, EP 3 10 550).

Die Wirkung dieser Derivate ist jedoch insbesondere bei niedrigen Aufwandmengen nicht immer befriedigend, häufig ist auch das Artenspektrum nicht ausreichend.

Es wurden neue 2-Anilino-pyrimidin-Derivate gefunden, die vorteilhafte Wirkungen bei der Bekämpfung eines breiten Spektrums phytopatogener Pilze, insbesondere bei niedrigen Dosierungen aufweisen.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher Verbindungen der Formel I



worin

R¹ = Wasserstoff, Halogen, (C₁-C₄)-Alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, Cyano-(C₁-C₄)-alkyl, Halo-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, Halo-(C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)-alkylthio, Halo-(C₁-C₄)-alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkinyl, (C₁-C₄)-Alkylamino, (C₁-C₄)-Dialkylamino, (C₃-C₉)-Cycloalkylamino, (C₁-C₄)-Alkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylaminocarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Alkylthiocarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylthiocarbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylthio-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylamino-(C₁-C₄)-alkyl, Phenoxyphenyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R¹ und R⁹ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten oder aromatischen Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N, S, Si oder P mit 4 bis 10 Ringgliedern,

R² = Wasserstoff, Formyl, (C₁-C₄)-Alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, Cyano-(C₁-C₄)-alkyl, Halo-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, Halo-(C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)-alkylthio, Halo-(C₁-C₄)-alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkinyl, (C₁-C₄)-Alkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylaminocarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Alkylthiocarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylthiocarbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylaminocarbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylthio-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylamino-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxyphenyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil

bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁–C₄)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy, (C₁–C₄)-Alkylthio, (C₁–C₄)-Haloalkyl, (C₁–C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert sein kann,

R³, R⁴, R⁵ = unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Cyano, Thiocyano, (C₁–C₄)-Alkyl, Cyano-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy, (C₁–C₄)-Alkylamino, (C₁–C₄)-Dialkylamino, (C₁–C₄)-Alkylcarbonylamino, Halo-(C₁–C₄)-alkyl, Hydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁–C₄)-alkylthio, Halo-(C₁–C₄)-alkylthio-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylthio-(C₁–C₄)-alkyl, (C₂–C₆)-Alkenyl, (C₂–C₆)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Dialkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁–C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁–C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁–C₄)-Alkoxy-carbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylaminocarbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Dialkylaminocarbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₁–C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkoxy-carbonyl, (C₁–C₄)-Alkylthiocarbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkylthiocarbonyl, Aminocarbonyl, (C₁–C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkylaminocarbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylloxycarbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylamino-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxyphenyl-(C₁–C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁–C₄)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy, (C₁–C₄)-Alkylthio, (C₁–C₄)-Haloalkyl, (C₁–C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R³, R⁴ und/oder R⁵ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten oder aromatischen Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N, S, Si oder P oder mit 4 bis 10 Ringgliedern,

R² und R³ und/oder R⁴ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N, S, Si oder P mit 4 bis 10 Ringgliedern,

R⁶, R⁶ = unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁–C₉)-Alkyl, Cyano-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkyl, Hydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkylthio-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylthio-(C₁–C₄)-alkyl, (C₂–C₆)-Alkenyl, (C₂–C₆)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Dialkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁–C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁–C₄)-Alkyl substituiert sein können, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylamino-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxyphenyl-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-5- oder 6gliedriger Heteroaromat, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil (Heteroaromat) bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁–C₄)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy, (C₁–C₄)-Alkylthio, (C₁–C₄)-Haloalkyl, (C₁–C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R⁶ und R⁷ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten oder teilweise ungesättigten Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N, S, Si oder P mit 4 bis 10 Ringgliedern bilden,

R⁸ = Wasserstoff, Halogen, (C₁–C₄)-Alkyl, Hydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, Cyano-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁–C₄)-alkylthio, Halo-(C₁–C₄)-alkylthio-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylthio-(C₁–C₄)-alkyl, (C₂–C₆)-Alkenyl, (C₂–C₆)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Dialkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, wobei ein C-Atom gegebenenfalls durch die Heteroatome O oder N substituiert sein kann, (C₃–C₉)-Cycloalkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁–C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁–C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁–C₄)-Alkoxy-carbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylaminocarbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Dialkylaminocarbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₁–C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkoxy-carbonyl, (C₁–C₄)-Alkylthiocarbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkylthiocarbonyl, Aminocarbonyl, (C₁–C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkylaminocarbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylloxycarbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-5- oder 6gliedriger Heteroaromat, gegebenenfalls substituiertes Phenylamino-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxyphenyl-(C₁–C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil (Heteroaromat) bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁–C₄)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy, (C₁–C₄)-Alkylthio, (C₁–C₄)-Haloalkyl, (C₁–C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R⁹ = Halogen, (C₁–C₄)-Alkyl, (C₁–C₉)-Alkoxy, Hydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, Cyano-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁–C₄)-alkylthio, Halo-(C₁–C₄)-alkylthio-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylthio-(C₁–C₄)-alkyl, (C₂–C₆)-Alkenyl, (C₂–C₆)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkylamino, (C₁–C₄)-Dialkylamino, (C₃–C₉)-Cycloalkylamino, (C₁–C₄)-Alkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Dialkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkyl-

lamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylaminocarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-Alkylthiocarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylthiocarbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylaminocarbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxyphenyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Säureester, Ester, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann, R¹ und R⁹ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten oder aromatischen Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N, S, Si oder P mit 4 bis 10 Ringgliedern bilden, X = O, S, NH oder N-(C₁-C₄)-Alkyl und n = eine Zahl von 0 bis 8 bedeuten, sowie deren Säureadditionssalze.

In Formel I bedeutet

R¹ bevorzugt Wasserstoff, Halogen, (C₁-C₄)-Alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, Perhalo-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, Halo-(C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkylamino, (C₁-C₄)-Dialkylamino, (C₃-C₉)-Cycloalkylamino, (C₁-C₄)-Alkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁-C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann.

R¹ ist insbesondere Wasserstoff, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, besonders bevorzugt Wasserstoff.

R² ist bevorzugt Wasserstoff, Formyl, (C₁-C₄)-Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio, Perhalo-(C₁-C₄)-alkylthio, (C₁-C₄)-Alkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁-C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann, insbesondere Wasserstoff, (C₁-C₄)-Alkyl oder Formyl, besonders bevorzugt Wasserstoff oder CHO, und

R³, R⁴, R⁵ bedeuten bevorzugt unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Cyano, Thiocyano, (C₁-C₄)-Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylamino, (C₁-C₄)-Dialkylamino, Halo-(C₁-C₄)-alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, Halo-(C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)-alkylthio, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl, (C₃-C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁-C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann.

R³, R⁴ und/oder R⁵ können zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten oder aromatischen Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N oder S mit 4 bis 10 Ringgliedern bilden und

R² und R³ und/oder R⁴ können zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N oder S mit 4 bis 10, insbesondere 5 oder 6 Ringgliedern bilden.

R³, R⁴, R⁵ ist insbesondere unabhängig voneinander Wasserstoff, Chlor, Brom, (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy, besonders bevorzugt Wasserstoff, F, Cl oder OCH₃.

R⁶, R⁷ sind bevorzugt unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₉)-Alkyl oder durch Halogen, (C₁-C₄)-Alkyl oder (C₁-C₄)-Alkoxy gegebenenfalls substituiertes Phenyl, insbesondere Wasserstoff oder (C₁-C₄)-Alkyl, besonders bevorzugt Wasserstoff.

R⁶ und R⁷ können zusammen einen gesättigten oder teilweise ungesättigten Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N oder S mit 4 bis 10, insbesondere 5 oder 6 Ringgliedern bilden.

R⁸ ist bevorzugt Wasserstoff, Halogen, (C₁-C₄)-Alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁-C₄)-alkyl,

(C₁—C₄)-Alkylthio, Perhalo-(C₁—C₄)-alkylthio, (C₂—C₆)-Alkenyl, (C₂—C₆)-Alkynyl, (C₁—C₄)-Alkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Dialkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Cycloalkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Cycloalkyl, (C₃—C₉)-Cycloalkyl-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁—C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁—C₄)-Alkyl substituiert sein können, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes 5- oder 6gliedriger Heteroaromat, beispielsweise Pyridin oder Thiophen, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil (Heteroaromat) bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁—C₄)-Alkyl, (C₁—C₄)-Alkoxy, (C₁—C₄)-Alkylthio, (C₁—C₄)-Haloalkyl, (C₁—C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann.

Insbesondere ist

R⁸ = Wasserstoff, Iod, (C₁—C₄)-Alkyl, Di-(C₁—C₄)-alkylamino-(C₁—C₄)-alkyl oder durch Halogen, (C₁—C₄)-Alkyl oder (C₁—C₄)-Alkoxy gegebenenfalls substituiertes Phenyl, besonders bevorzugt Wasserstoff.

R⁹ ist bevorzugt Halogen, (C₁—C₄)-Alkyl, (C₁—C₃)-Alkoxy, Hydroxy-(C₁—C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁—C₄)-alkyl, Cyano-(C₁—C₄)-alkyl, Halo-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Alkoxy-(C₁—C₄)-alkyl, Halo-(C₁—C₄)-alkoxy-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁—C₄)-alkylthio, Halo-(C₁—C₄)-alkylthio-(C₁—C₄)-alkyl, (C₂—C₆)-Alkenyl, (C₂—C₆)-Alkynyl, (C₁—C₄)-Alkylamino, (C₁—C₄)-Dialkylamino, (C₃—C₉)-Cycloalkylamino, (C₁—C₄)-Alkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Dialkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Cycloalkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Cycloalkyl, (C₃—C₉)-Cycloalkyl-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁—C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁—C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁—C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁—C₄)-Alkoxy-carbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁—C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁—C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁—C₄)-alkoxy, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁—C₄)-Alkyl, (C₁—C₄)-Alkoxy, (C₁—C₄)-Alkylthio, (C₁—C₄)-Haloalkyl, (C₁—C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann.

R⁹ ist insbesondere Halogen, (C₁—C₄)-Alkyl, (C₁—C₄)-Alkoxy, Phenyl-(C₁—C₄)-alkoxy, Cyano-(C₁—C₄)-alkyl oder (C₁—C₄)-Alkoxy-carbonyl-(C₁—C₄)-alkyl, besonders bevorzugt Br oder OCH₃.

R¹ und R⁹ können zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten oder aromatischen Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N oder S mit 4 bis 10, insbesondere 5 oder 6 Ringgliedern bilden,

X ist bevorzugt O oder NH und

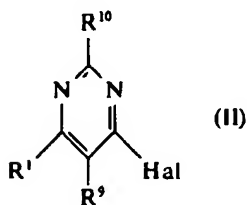
n ist eine Zahl von 0 bis 4, insbesondere 0 oder 1.

Halo bedeutet in den einzelnen Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert.

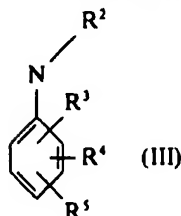
Zur Herstellung der Säureadditionssalze der Verbindungen der Formel I kommen folgende Säuren in Frage: Halogenwasserstoffsäuren wie Chlorwasserstoffsäure oder Bromwasserstoffsäure, Phosphorsäure, Salpetersäure, Schwefelsäure, mono- oder bifunktionelle Carbonsäuren und Hydroxycarbonsäuren wie Essigsäure, Maleinsäure, Bernsteinsäure, Fumarsäure, Weinsäure, Citronensäure, Salicylsäure, Sorbinsäure oder Milchsäure sowie Sulfonsäuren wie p-Toluolsulfonsäure oder 1,5-Naphthalindisulfonsäure. Die Säureadditionsverbindungen der Formel I können in einfacher Weise nach den üblichen Salzbildungsmethoden, z. B. durch Lösen einer Verbindung der Formel I in einem geeigneten organischen Lösungsmittel und Hinzufügen der Säure, erhalten werden und in bekannter Weise, z. B. durch Abfiltrieren, isoliert und gegebenenfalls durch Waschen mit einem inerten organischen Lösungsmittel gereinigt werden.

Die Pyrimidine der Formel I können nach verschiedenen mehrstufigen Verfahren hergestellt werden.

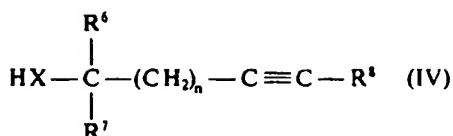
Man erhält die erfindungsgemäßen Verbindungen, indem man Verbindungen der Formel II



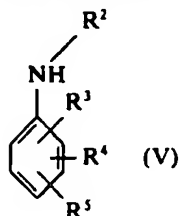
worin Hal=Cl oder Br und R¹⁰=(C₁—C₄)-Alkylthio, im Phenylteil durch Halogen, (C₁—C₄)-Alkyl oder (C₁—C₄)-Alkoxy gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁—C₄)-alkylthio, S oder den Rest III



bedeuten, mit Verbindungen der Formel IV



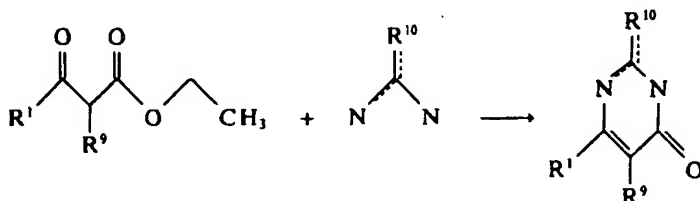
umsetzt und, falls R^{10} eine von der Formel III abweichende Bedeutung hat, anschließend die erhaltenen Verbindungen im Rest R^{10} oxidiert und die entstandenen Oxidationsprodukte mit Verbindungen der Formel V



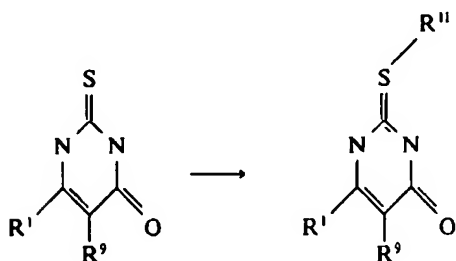
zu den Endprodukten der Formel I mit $\text{R}^{10} = \text{Rest}$ der Formel III umsetzt sowie gegebenenfalls, wenn $\text{R}^8 = \text{H}$, den Wasserstoff gegen Halogene austauscht.

Die Ausgangsstoffe der Formel I erhält man nach einer Anzahl literaturbekannter Verfahren.

Durch Kondensation geeigneter 3-Ketocarbonsäureester mit Thioharnstoff, S-alkylierten Thioharnstoffen, Guanidin oder Guanidinderivaten, wobei sie in reiner Form oder in situ aus ihren Salzen freigesetzt eingesetzt werden können, ohne Lösungsmittel oder in einem geeigneten aprotischen oder protischen Lösungsmittel (Wasser, niedere Alkohole), bei Temperaturen von 0°C bis 160°C , bevorzugt bei Temperaturen zwischen Raumtemperatur und der Siedetemperatur des Lösungsmittels, in Gegenwart einer geeigneten Base, wie Alkalicarbonat (Na_2CO_3 oder K_2CO_3) oder Alkalialkoholate (NaOMe oder NaOEt), zu entsprechenden 4-Pyrimidinonen.

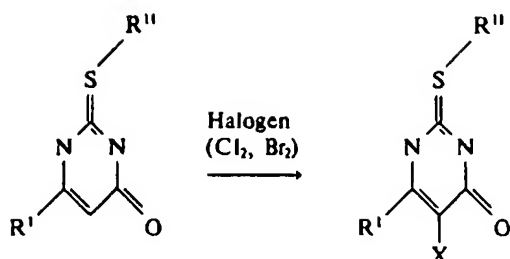


Die Modifizierung bekannter Pyrimidinone oder Mercaptopyrimidinone erfolgt dagegen mit einem Alkylierungsmittel, wie Alkylhalogenide (z. B. Methyljodid) oder Alkylsäureester (z. B. Dimethylsulfat, Phosphorsäuretrimethylester), unter Verwendung einer Base, beispielsweise NaOH oder Triethylamin, in einem geeigneten protischen oder aprotischen Lösungsmittel (DMF, Acetonitril, Wasser) bei Temperaturen von 0°C bis 260°C , bevorzugt im Temperaturbereich zwischen 50°C und der Siedetemperatur des Lösungsmittels.



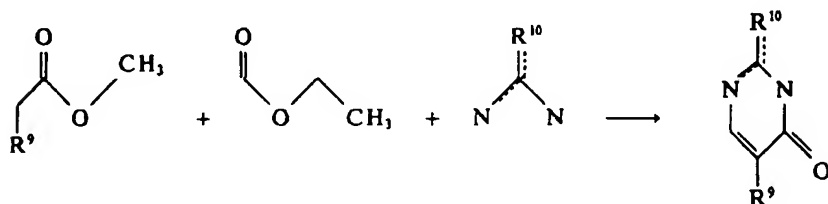
R^{11} steht in diesem und in den folgenden Formelschemata für (C_1-C_4) -Alkyl, (C_1-C_4) -Alkyl-phenyl, im Phenylteil durch Halogen, (C_1-C_4) -Alkyl oder (C_1-C_4) -Alkoxy gegebenenfalls substituiertes (C_1-C_4) -Alkyl-phenyl.

Für die Herstellung der Pyrimidine der Formel II mit $\text{R}^9 = \text{X} = \text{Halogen}$ ist die Umsetzung geeigneter 4-Pyrimidinone mit elementaren Halogenen in einem aprotischen oder protischen Lösungsmittel wie Essigsäure zu bevorzugen (Beilstein, 3/4. Ergänzungswerk, Band 25, S. 56).

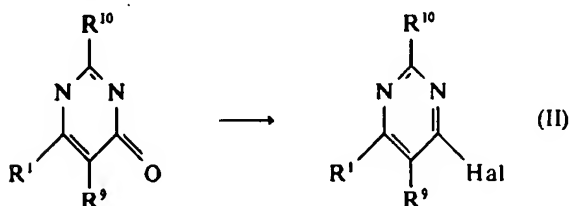


Verbindungen der Formeln II mit R^1 = Wasserstoff können in Anlehnung an entsprechende Literaturvorschriften (Beilstein, 3/4. Ergänzungswert, Band 25, S. 279) 2stufig in einem Eintopfverfahren hergestellt werden. Zunächst werden in einem inerten Lösungsmittel wie Toluol, THF, Dioxan oder Diethylether entsprechende Carbonsäurederivate mit einer geeigneten Base, im allgemeinen mit Alkalihydrid (NaH) oder Alkalialkoholat (NaOMe) anionisiert und dann mit einem Ameisenester formyliert.

Die anschließende Kondensation kann mit Thioharnstoff, S-alkylierten Thioharnstoffen, Guanidin oder Guanidinderivaten erfolgen, wobei diese in reiner Form oder in situ, mittels Basen (Alkoholate wie NaOMe) aus ihren Salzen freigesetzt, eingesetzt werden können. Als besonders für die Kondensation geeignet haben sich protische Lösungsmittel, insbesondere niedere Alkohole, erwiesen.



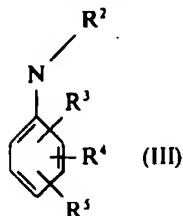
Die so erhaltenen 4-Pyrimidinone können mit überschüssigem POCl_3 (POBr_3) ohne Lösungsmittel in einem gegen POCl_3 (POBr_3) inerten Lösungsmittel oder in einem basischen Lösungsmittel wie DMF ohne oder mit einem Säurefänger, wie N,N-Dimethylanilin in 0,001 bis 2 Moläquivalenten, vorzugsweise 0,02 Äquivalenten, bei Temperaturen von 50°C bis 110°C , vorzugsweise bei der Siedetemperatur des POCl_3 (POBr_3), in die entsprechenden 4-Halogenpyrimidine überführt werden (vergl. Beilstein, Hauptwerk, Band 25, S. 372, Beilstein, 3/4. Ergänzungswert, Band 23, S. 2471).



Die Verbindungen der Formel II sind größtenteils bekannt bzw. können in analoger, dem Fachmann geläufiger Weise hergestellt werden. Die Umsetzung von II und IV (mit $X = \text{O}$ oder S) erfolgt in Abhängigkeit von der Reaktivität der Derivate in einem inerten Lösungsmittel (Toluol, THF) bei Temperaturen von 0°C bis 150°C , vorzugsweise von 25°C bis 50°C (vergl. Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A. R. Katritzky, C. W. Rees, Pergamon Press, Oxford, New York, 1984, Vol. 3, S. 100).

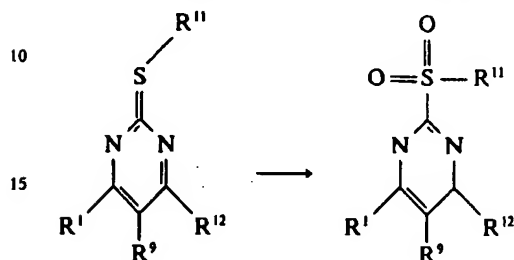
In analoger Weise kann man auch entsprechende Amine der Formel IV (mit $X = \text{NH}$ oder $\text{N}-(\text{C}_1-\text{C}_4)\text{-Alkyl}$) in geeigneten Lösungsmitteln wie DMF, Acetonitril oder DMSO mit 4-Halogenpyrimidinen umsetzen, wobei hier die entstehende HCl (HBr) mit einer Base, z. B. Triethylamin, abgefangen werden sollte.

Sofern die zur Synthese der erfindungsgemäßen Verbindungen benötigten, den Rest III

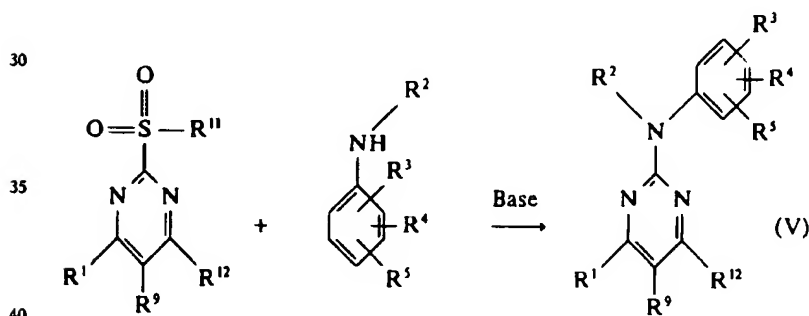


enthaltenden Pyrimidin-Derivate der Formel II nicht zur Verfügung stehen, kann man diesen Rest nachträglich in die zunächst erhaltenen Umsetzungsprodukte von II (mit $R^{10} \neq$ Rest der Formel III) und IV einführen. Hierzu

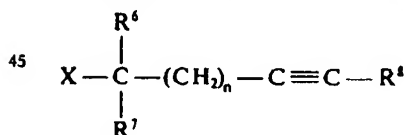
kann bei entsprechenden 2-Alkylmercaptopyrimidinen die schwefeltragende Gruppe oxidiert werden. Die Oxidation kann nach üblichen Verfahren mit einem geeigneten Oxidationsmittel wie Peroxide (z. B. H_2O_2), Permanganat, Perbenzoesäuren oder mit einer Mischung aus Kaliumperoxomonosulfat, $2KHSO_5$, $KHSO_4$ und K_2SO_4 in einem Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch (z. B. Wasser, Essigsäure, Methanol) oxidiert werden (vergl. Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A. R. Katritzky, C. W. Rees, Pergamon Press, Oxford, New York, 1984, Vol. 3, S. 96; D. J. Brown, B. T. England, J. Chem. Soc. [C] [1971], 256). Die Oxidation kann auch mittels Katalysatoren gestartet oder beschleunigt werden.



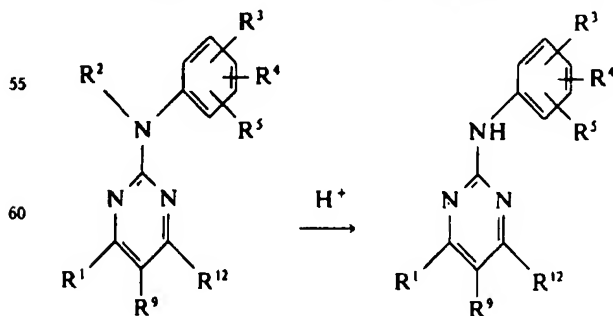
20 Im nächsten Schritt kann der Austausch der Sulfonylgruppe gegen Anilinderivate erfolgen. In einem inerten Lösungsmittel, beispielsweise Toluol oder THF, wird das Anilin-Derivat mittels einer Base, vorzugsweise Alkalihydrid, insbesondere NaH, anionisiert. Die Reaktion mit dem Pyrimidin erfolgt dann bei Temperaturen von $0^\circ C$ bis $100^\circ C$, wobei zur Vermeidung von Nebenreaktionen, insbesondere für die Fälle, in denen die Verbindungen der Formel I mit R^1 und R^{12} = Halogen oder eine Gruppe mit einer Doppel- oder Dreifachbindung bedeuten, möglichst niedrige Temperaturen anzustreben sind. Ähnliche Verfahren sind in der Literatur beschrieben (vergl. Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A. R. Katritzky, C. W. Rees, Pergamon Press, Oxford, New York, 1984, Vol. 3, S. 97).



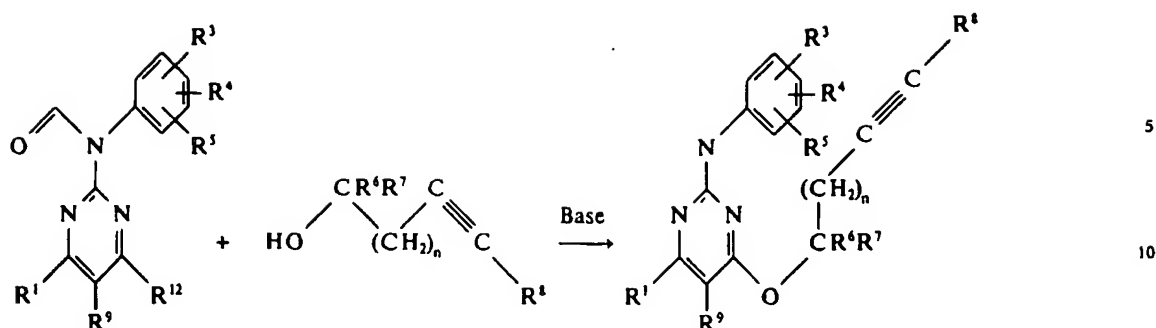
R^{12} steht in diesem und in den folgenden Formelschemata für Halogen, insbesondere Chlor, oder



50 Für Verbindungen der Formel I mit $R^2 = CHO$ kann der Substituent einer Protonenkatalyse in einem geeigneten Lösungsmittel (z. B. HCl in EtOH) abgespalten werden.

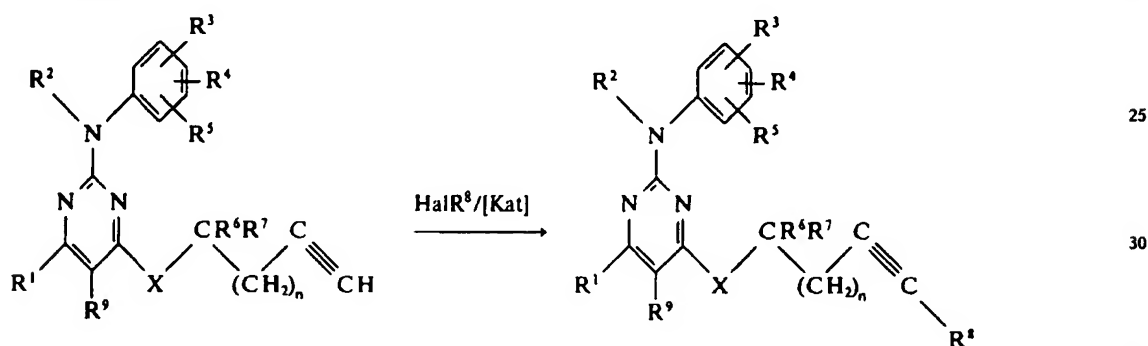


Ist in den erfindungsgemäßen Verbindungen R^{12} = Halogen, kann der oben beschriebene Austausch des Halogens unter entsprechenden Bedingungen als letzter Schritt vorgenommen werden. Für den Fall, daß in Verbindungen der Formel I $R^2 = CHO$ ist, erfolgt bereits hier die Abspaltung der Formylgruppe.



Eine Methode zur Modifizierung von Edukten zur Herstellung von Verbindungen der Formel I ist die Übergangsmetall-katalysierte Arylierung der Alkinylfunktion (vergl. M. Fieser, L. F. Fieser, Reagents für Organ-
ic Synthesis, John Wiley and Sons, New York, 1977, Vol. 6, S. 59ff.). So kann man beispielsweise in Mischungen
aus inerten und basischen Lösungsmitteln oder in basischen Lösungsmitteln (Triethylamin) Alkine mit haloge-
nierten (jodierten) Aromaten oder Heteroaromaten zur Reaktion bringen, wobei bevorzugt Pd-Katalysatoren
verwendet werden.

15
20



Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I können zum Schutz verschiedener Kulturpflanzen gegen
pathogene Mikroorganismen, insbesondere Fungi, eingesetzt werden, wobei sie sich durch eine besonders hohe
Kulturpflanzenverträglichkeit auszeichnen. Sie besitzen vorteilhafte präventive und systemische Eigenschaften.
Bereits in das pflanzliche Gewebe eingedrungene pilzliche Krankheitserreger lassen sich auch erfolgreich
kurativ bekämpfen. Durch Besprühen, Bestäuben oder andere Applikationen mit Wirkstoffen der Formel I
können Pflanzen und bestehende oder zuwachsende Pflanzenteile vor auftretenden Schädlingen geschützt
werden. Sie eignen sich auch als Beizmittel zur Behandlung von Saatgut und Stecklingen zum Schutz vor
Pilzinfektionen sowie im Erdboden auftretende pathogene Pilze. Das Wirkungsspektrum der beanspruchten
Verbindungen erfaßt eine Vielzahl verschiedener wirtschaftlich bedeutender, phytopathogener Pilze, wie *Alter-*
naria mali, *Botrytis cinerea*, benzimidazol- und/oder dicarboximidsensible und resistente Stämme, *Sclerotinia*
sclerotiniorum sowie weitere Grauschimmelarten, *Cercospora beticola*, *Ceratobasidium cereale*, *Erysiphe gra-*
minis, *Erysiphe graminis hordei*, *Erysiphe chichoracearum* sowie andere Echte Mehltauarten, *Fusarium culmo-*
rum und andere *Fusarium*arten, *Monilinia*arten, *Leptosphaeria nodorum* sowie andere *Septoria*arten und blatt-
fleckenverursachende Arten, *Pellicularia sasakii*, *Piricularia oryzae* und andere Reispilzarten, *Phytophthora*
infestans, *Phytophthora capsici* und verschiedene andere Kraut- und Knollenfäulepilze, *Plasmopara viticola*,
Pseudoperonospora cubensis und weitere *Pernospora* oder falsche Mehltauarten, *Pseudocercospora herpotri-*
choides und verschiedene andere Augenflecken bzw. Halmbruch verursachende Pilzarten, *Puccinia recondita*
und verschiedene andere Rostpilze, *Pyrenophora teres* und andere Drechslerarten, *Ustilago*arten, *Venturia*
inaequalis und Schorfarten, wobei jedoch die Wirkung gegen Ascomyceten und Deuteromyceten und insbeson-
dere gegen BCM-resistente *Pseudocercospora herpotrichoides*-Stämme hervorzuheben ist.

40
45
50
55

Die erfindungsgemäßen Verbindungen eignen sich daneben auch für den Einsatz in technischen Bereichen,
beispielsweise als Holzschutzmittel, als Konservierungsmittel in Anstrichfarben, in Kühlschmiermittel für die
Metallbearbeitung oder als Konservierungsmittel in Bohr- und Schneidölen.

Gegenstand der Erfindung sind auch Mittel, die die Verbindungen der Formel I neben geeigneten Formulie-
rungshilfsmitteln enthalten. Die erfindungsgemäßen Mittel enthalten die Wirkstoffe der Formel I im allgemeinen
zu 1 bis 95 Gew.-%.

60

Sie können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem wie es durch die biologischen und/oder
chemisch-physikalischen Parameter vorgegeben ist. Als Formulierungsmöglichkeiten kommen daher in Frage:
Spritzpulver (WP), emulgierbare Konzentrate (EG), wäßrige Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis (SC),
Suspensionen (SC), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate in Form von wasserdispergierbare Granulate
(WG), ULV-Formulierungen, Mikrokapseln, Wachse oder Köder.

65

Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und werden beispielsweise beschrieben in:
Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser-Verlag München, 4. Aufl. 1986; van Falken-

berg, "Pesticides Formulations", Marcel Dekker N.Y., 2nd Ed. 1972—73; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Die notwendigen Konservierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside, Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und werden beispielsweise beschrieben in:

- 5 Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carrier", 2nd Ed., Darland Books, Galdwell N.J.; H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry, 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; Marschen, "Solvents Guide 1", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1950; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

Auf der Basis dieser Formulierungen lassen sich auch Kombinationen mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren herstellen, z. B. in Form einer Fertigformulierung oder als Tankmix.

- 15 Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Netzmittel, z. B. polyoxethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, Alkyl- oder Alkylphenolsulfonate und Dispergiermittel, z. B. ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium, dibutyl-naphthalin-sulfonsaures Natrium oder auch oleylmethylaurinsäures Natrium enthalten. Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösungsmittel, z. B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten
- 20 oder Kohlenwasserstoffen unter Zusatz von einem oder mehreren Emulgatoren hergestellt.

Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calciumsalze wie Ca-dodecylbenzolsulfonat oder nichtionogene Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykolester, Fettalkoholpolyglykolether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Sorbitanfettsäureester, Polyoxyethylensorbitan-Fettsäureester oder Polyoxethylensorbitester.

- 25 Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z. B. Talkum, natürlichen Tonen wie Kaolin, Bentonit, Poryphillit oder Diatomeenerde. Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebemitteln, z. B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem
- 30 Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise — gegebenenfalls in Mischung mit Düngemitteln — granuliert werden.

In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubbörmige Formulierungen enthalten meistens 5 bis 20 Gew.-%. Bei Granulaten hängt

- 35 der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden.

Daneben enthalten die genannten Wirkstoffformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Lösungsmittel, Füll- oder Trägerstoffe.

- 40 Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Konzentrate gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt, z. B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und teilweise auch bei Mikrogranulaten mittels Wasser.

Staubbörmige und granuliert Zubereitungen sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

- 45 Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit u. a. variiert die erforderliche Aufwandmenge. Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z. B. von 0,005 bis 10,0 kg/ha, vorzugsweise liegt sie jedoch im Bereich von 0,01 bis 5 kg/ha.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in ihren handelsüblichen Formulierungen entweder allein oder in Kombination mit weiteren, literaturbekannten Fungiziden angewendet werden.

- 50 Als literaturbekannte Fungizide, die erfindungsgemäß mit den Verbindungen der Formel I kombiniert werden können, sind beispielsweise folgende Produkte zu nennen: Imazalil, Prochloraz, Fenapanil, SSF 105, Triflumizol, PP 969, Flutriafof, BAY-MEB 6401, Propiconazol, Etaconazol, Diclobutrazol, Bitertanol, Triadimefon, Triadime-nol, Tebuconazole, Fluotrimazol, Tridemorph, Dodemorph, Fenpropimorph, Falimorph, Dimethomorph, S-32165, Chlobenzthiazole, Parinol, Buthiobat, Fenpropidin, Triforine, Fenarimol, Nuairimol, Triarimol, Ethiri-mol, Dimethirimol, Bupirimate, Rabenzazole, Tricvclazole, Fluobenzimine, Pyroxyfur, NK-483, PP-389, Pyroqui-lon, Hymexazole, Fenitropan, UHF-8227, Cymoxanil, Dichlofuranid, Captafol, Captan, Folpet, Tolyfluamid, Chlo-rothalonil, Etridiazol, Iprodione (Formel II), Procymidon, Vinclozol, Metomeclan, Myclozolin, Dichlozolinat, Fluorimide, Drazoxolan, Chinomethionate, Nitrothalisopropyl, Dithianon, Dinocap, Binapacryl, Fentinacetate, Fentinhydroxide, Carboxin, Oxycarboxin, Pyracarolid, Methfuroxam, Fenfura, Furmecyclos, Benodanil, Mebenil, Mepronil, Flutalanil, Fuberidazole, Thiabendazole, Carbendazim, Benomyl, Thiofante, Thiofanatemethyl, CGD-
- 60 95340 F, IKF-1216, Mancoczeb, Maneb, Zineb, Nabam, Thiram, Probineb, Prothiocarb, Propamocarb, Dodine, Guazatine, Dicloran, Quintozene, Chloroneb, Tecnazene, Biphenyl, Anilazine, 2-Phenylphenol, Kupferverbin-dungen wie Cu-oxychlorid, Oxine-Cu, Co-oxide, Schwefel, Fosethylaluminium, Natriumdodecylbenzolsulfonat, Natrium-dodecylsulfat, Natrium-C13/C15-alkoholethersulfonat, Natrium-cetostearylphosphatester, Dioctyl-na-triumsulfo-succinat, Natrium-isopropyl-naphthalinsulfonat, Natrium-methylenbisnaphthalinsulfonat, Cetyl-trime-thyl-ammoniumchlorid.

Salze von langkettigen primären, sekundären oder tertiären Aminen, Alkyl-propylenamine, Lauryl-pyridini-um-bromid, ethoxylierte quaternierte Fettamine, Alkyl-dimethyl-benzylammoniumchlorid und 1-Hydroxyethyl-2-alkyl-imidazolin.

Die oben genannten Kombinationspartner stellen bekannte Wirkstoffe dar, die zum großen Teil in CH. R. Worthing, U. S. B. Walker, The Pesticide Manual, 7. Auflage (1983), British Crop Protection Council, beschrieben sind.

Darüber hinaus können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe, insbesondere die der aufgeführten Beispiele, in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit anderen Wirkstoffen wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Akaraziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden vorliegen. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, Formamidine, Zinnverbindungen, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u. a. Bevorzugte Mischungspartner sind:

1. aus der Gruppe der Phosphorsäureester

Azinphos-ethyl, Azinphos-methyl, 1-(4-Chlorphenyl)-4-(O-ethyl, S-propyl)-phosphoryl-oxypyrazol (TIA-230), Chlorpyrifos, Coumaphos, Demeton, Demeton-S-methyl, Diazinon, Dichlorvos, Dimethoat, Ethoprophos, Etrifos, Fenitrothion, Fenthion, Heptenphos, Parathion, Parathion-methyl, Phosalon, Pirimiphos-ethyl, Pirimiphos-methyl, Profenofos, Prothiofos, Sulprofos, Triazophos, Tichlorphon.

2. aus der Gruppe der Carbamate

Aldicarb, Bendiocarb, BPMC (2-(1-Methylpropyl)phenylmethylcarbamate), Butocarboxim, Butoxycarboxim, Carbaryl, Carbofuran, Carbosulfan, Cloethocarb, Isoprocab, Methomyl, Oxamyl, Primidicarb, Promecarb, Propoxur, Thiodicarb.

3. aus der Gruppe der Carbonsäureester

Allethrin, Alphamethrin, Bioallethrin, Bioresmethrin, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cypermethrin, Deltamethrin, 2,2-Dimethyl-3-(2-chlor-2-trifluormethylvinyl)cyclopropanecarbonsäure-(alpha-cyano-3-phenyl-2-methyl-benzyl)ester (FMC 54800), Fenprothrin, Fenluthrin, Fenvalerat, Flucythrinate, Flumethrin, Fluvalinate, Permethrin, Resmethrin, Tralomethrin.

4. aus der Gruppe der Formamidine

Amitraz, Chlordimeform.

5. aus der Gruppe der Zinnverbindungen

Azocyclotin, Cyhexatin, Fenbutatinoxid.

6. Sonstige

Abamektin, Bacillus thuringiensis, Bensultap, Binapaclyl, Bromopropylate, Buprofecin, Camphechlor, Cartap, Chlorbenzilate, Chlorfluazuron, 2-(4-Chlorphenyl)-4,5-diphenylthiophen (UBI-T 930), Chlofentezine, Cyclopropanecarbonsäure-(2-naphthylmethyl)-ester (Ro 12-0470), Cyromacin, DDT, Dicofol, N-(3,5-Dichlor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroethoxy)phenylamino)-carbonyl-2,6-difluorbenzamide (XRD 473), Diflubenzuron, N-(2,3-Dihydro-3-methyl-1,2-thiazol-2-ylidene)-2,4-xylydine, Dinobuton, Dinocap, Endosulfan, Fenoxycarb, Fenthion, Flubenzimine, Flufenoxuron, Gamma-HCH, Hexythiazox, Hydramethylnon (AC 217 300), Ivermectin, 2-Nitro-methyl-4,5-dihydro-6H-thiazin (SD 52618), 2-Nitromethyl-3,4-dihydrothiazol (SD 35651), 2-Nitromethylene-1,3-thiazinan-3-yl-carbomaldehyde (WL 108 477), Propargite, Teflubenzuron, Tetradifon, Tetrasul, Thicyclam, Triflumarol, Kernpolyeder- und Granuloseviren.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren, die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0001 bis zu 100 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise von 0,001 bis 1 Gew.-%, liegen. Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weisen.

Nachfolgende Beispiele dienen zur Erläuterung der Erfindung.

A. Formulierungsbeispiele

a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile Wirkstoff und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.

b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gew.-Teile Wirkstoff, 65 Gew.-Teile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gew.-Teile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.

c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat stellt man her, indem man 40 Gew.-Teile Wirkstoff mit 7 Gew.-Teilen eines Sulfobernsteinsäurehalbesters, 2 Gew.-Teilen eines Ligninsulfonsäure-Natriumsalzes und 51 Gew.-Teilen Wasser mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.

d) Ein emulgierbares Konzentrat läßt sich herstellen aus 15 Gew.-Teilen Wirkstoff, 75 Gew.-Teilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertem Nonylphenol (10 AeO) als Emulgator.

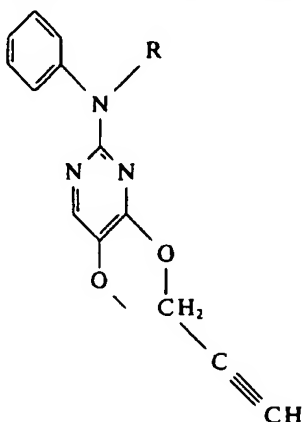
e) Ein Granulat läßt sich Herstellen aus 2 bis 15 Gew.-Teilen Wirkstoff und einem inerten Granulatträgermaterial wie Attapulgit, Bimsgranulat und/oder Quarzsand. Zweckmäßigerweise verwendet man eine Suspension des Spritzpulvers aus Beispiel b) mit einem Feststoffanteil von 30% und spritzt diese auf die Oberfläche eines Attapulgitgranulats, trocknet und vermischt innig.

Dabei beträgt der Gewichtsanteil des Spritzpulvers ca. 5% und der des inerten Trägermaterials ca. 95% des fertigen Granulats.

B. Chemische Beispiele

Beispiel 1

5-Methoxy-N-phenyl-4-propinyloxy-2-pyrimidinamin und
N-Formyl-5-methoxy-N-phenyl-4-propinyloxy-2-pyrimidinamin



R = H: Verbindung Nr. 1

R = CHO: Verbindung Nr. 276

Zu 30 g NaH (80% in Mineralöl) in 600 ml abs. THF tropfte man 15% einer Mischung aus 118 g Ameisensäureethylester und 104 g Methoxyessigsäuremethylester und erwärmte das Reaktionsgemisch gelinde, bis eine Wasserstoffentwicklung festzustellen war. Den restlichen Anteil der obigen Mischung tropfte man anschließend so zu, daß die Reaktionstemperatur bei 35–40°C lag und eine mittlere Wasserstoffentwicklung beobachtet wurde. Hierbei bildete sich ein schwer rührbares Reaktionsgemisch. Nach Stehenlassen des Gemischs über 16 Stunden gab man 600 ml Isopropanol, 54 g Natriummethanolat und 153 g S-Methylisoharnstoffsulfat hinzu und erhitzte dieses Reaktionsgemisch 120 Minuten unter Rückfluß, wobei das THF teilweise abdestilliert wurde. Anschließend destillierte man die Lösungsmittel ab und nahm den Rückstand in Wasser auf, säuerte mit Essigsäure an und erhielt nach dem Abfiltrieren 133 g (84%) 5-Methoxy-2-methylthio-4-(1H)-pyrimidinon, Smp.: 190–195°C.

In 600 ml POCl₃ und 20 ml N,N-Dimethylanilin erhitzte man 209 g 5-Methoxy-2-methylthio-4-(1H)-pyrimidinon unter Rückfluß. Nach vollständiger Lösung des Pyrimidions (ca. 60 Minuten) destillierte man bei ca. 200 mm Hg das POCl₃ ab, nahm in Methylenchlorid auf und hydrolysierte, wusch die organische Phase neutral, trocknete diese und destillierte das Lösungsmittel ab (Sdp.: 110–114°C/0,2 mm Hg). Man erhielt 192 g (84%) 4-Chlor-5-methoxy-2-methylthiopyrimidin, Smp.: 74°C.

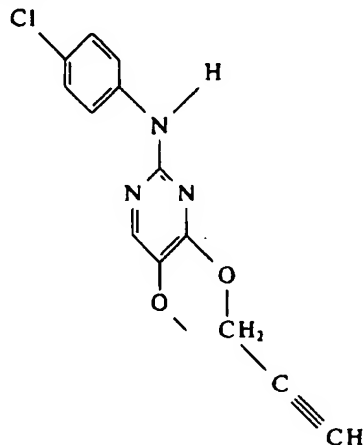
Zu 7,5 g NaH (80% in Mineralöl) in 200 ml abs. THF tropfte man 14 g Propinylalkohol, rührte eine Stunde und gab dann 38,1 g 4-Chlor-5-methoxy-2-methylthiopyrimidin hinzu. Nach 16 Stunden hydrolysierte man, extrahierte mit Essigester oder Methylenchlorid, wusch die organische Phase, trocknete diese und erhielt nach Abdestillieren des Lösungsmittels 38,6 g (92%) 5-Methoxy-2-methylthio-4-propinyloxy-2-pyrimidin, Smp.: 82°C.

Man suspendierte 80,3 g einer Mischung aus Kaliumperoxomonosulfat, 2 KHSO₅, KHSO₄ und K₂SO₄ in einer Mischung aus jeweils 100 ml Methanol, Wasser und Essigsäure, gab unter Rühren 21 g 5-Methoxy-4-propinyloxy-2-methylthiopyrimidin hinzu. Nach Abklingen der exothermen Reaktion (ca. 1 Stunde) extrahierte man mit reichlich Methylenchlorid, wusch die organische Phase und erhielt nach dessen Trocknung und Abdestillieren des Lösungsmittels 21,3 g (88%) 5-Methoxy-2-methylsulfonyl-4-propinyloxy-2-pyrimidin, Smp.: 131°C.

Zu 1,3 g NaH (80% in Mineralöl) in 100 ml abs. Toluol gab man 5,3 g Formanilid, rührte ca. 1 Stunde, gab dann 9,7 g 5-Methoxy-2-methylsulfonyl-4-propinyloxy-2-pyrimidin hinzu und rührte weitere 16 Stunden. Nach dem Hydrolysieren trennte man die organische Phase ab, extrahierte die wäßrige Phase mit Essigester, trocknete die vereinigten organischen Phasen und destillierte das Lösungsmittel ab. Das erhaltene Produktgemisch trennte man säurechromatographisch mit Essigester und Heptan (4 : 6) als Laufmittel. Man erhielt als erste Fraktion 1,4 g (14%) 5-Methoxy-N-phenyl-4-propinyloxy-2-pyrimidinamin, Smp.: 139–141°C, und als 2. Fraktion 3,0 g (26%) N-Formyl-5-methoxy-N-phenyl-4-propinyloxy-2-pyrimidinamin, Smp.: 78–82°C.

Beispiel 2

2-(4-Chloranilino)-5-methoxy-4-propinyloxy-pyrimidin



Verbindung Nr. 121

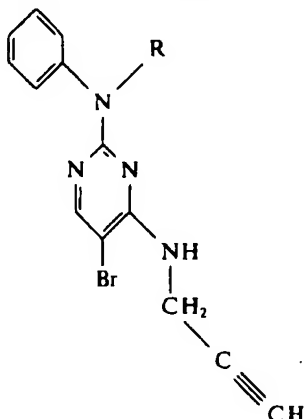
Zu 16,5 g NaH (80% in Mineralöl) in 300 ml abs. THF tropfte man 30% einer Mischung aus 59,2 g Ameisensäureethylester und 52,0 g Methoxyessigsäuremethylester und erwärmte das Reaktionsgemisch gelinde, bis eine Wasserstoffentwicklung festzustellen war. Die restlichen 70% der obigen Mischung tropfte man anschließend so zu, daß die Reaktionstemperatur bei 35–40°C lag und eine mittlere Wasserstoffentwicklung beobachtet wurde. Hierbei bildete sich ein schwer rührbares Reaktionsgemisch. Nach Stehenlassen des Gemischs über 16 Stunden gab man 300 ml Isopropanol, 27,1 g Natriummethanolat und 116 g 4-Chlorphenylguanidin-nitrat hinzu und erhitzte dieses Reaktionsgemisch 120 Minuten unter Rückfluß, wobei das THF teilweise abdestilliert wurde. Anschließend destillierte man die Lösungsmittel ab und nahm den Rückstand in Wasser auf, säuerte mit Essigsäure an und erhielt nach Abfiltrieren 110 g (89%) 2-(4-Chloranilino)-5-methoxy-4-(1H)-pyrimidinon, Smp.: 214–217°C.

In 250 ml POCl₃ und 10 ml N,N-Dimethylanilin erhitzte man 50,4 g 2-(4-Chloranilino)-5-methoxy-4-(1H)-pyrimidinon unter Rückfluß. Nach vollständiger Lösung des Pyrimidions (ca. 60 Minuten) destillierte man bei ca. 200 mm Hg das POCl₃ ab, nahm in Methylenchlorid auf und hydrolysierte, wusch die organische Phase neutral, trocknete diese und destillierte das Lösungsmittel ab. Nach der Reinigung durch Säulenchromatographie, mit Essigester und Heptan (7 : 3) als Laufmittel, erhielt man 7,5 g (13%) 4-Chlor-2-(4-chloranilino)-5-methoxy-pyrimidin, Smp.: 178–179°C.

Zu 1,0 g NaH (80% in Mineralöl) in 100 ml abs. THF tropfte man 1,8 g Propinylalkohol, rührte eine Stunde und gab dann 6,0 g 4-Chlor-2-(4-chloranilino)-5-methoxy-pyrimidin hinzu. Nach 16 Stunden hydrolysierte man, extrahierte mit Essigester oder Methylenchlorid, wusch die organische Phase, trocknete diese und erhielt nach Abdestillieren des Lösungsmittels und Reinigung durch Säulenchromatographie, mit Essigester und Heptan (7 : 3) als Laufmittel, 1,8 g (28%) 2-(4-Chloranilino)-5-methoxy-4-propinyloxy-pyrimidin, Smp.: 138–140°C.

Beispiel 3

5-Brom-N-phenyl-4-propinylamino-2-pyrimidinamin und
5-Brom-N-formyl-N-phenyl-4-propinylamino-2-pyrimidinamin



R = H: Verbindung Nr. 195
R = CHO: Verbindung Nr. 292

Zu 200 g NaOH in 1200 ml Wasser gab man 171 g 2-Thiouracil (97%), tropfte dann 164 g (123 ml) Dimethylsulfat hinzu und erhitze 90 Minuten unter Rückfluß. Nach dem Abkühlen des Reaktionsgemisches säuerte man mit konz. Salzsäure bis pH 1 an und erhielt durch Abfiltrieren 161,4 g (87%) 2-Methylmercapto-4-(1H)-pyrimidinon, Smp.: 197–200°C.

In 800 ml Essigsäure legte man 142,2 g 2-Methylmercapto-4-(1H)-pyrimidinon vor und tropfte 159,8 g Brom in das Gemisch. Nach 16 Stunden gab man das Reaktionsgemisch auf 3 kg Eiswasser und erhielt nach Abfiltrieren 201 g (90%) 5-Brom-2-methylmercapto-4-(1H)-pyrimidinon, Smp.: 243–245°C.

In 250 ml POCl₃ und 3 ml N,N-Dimethylanilin erhitze man 59,5 g 5-Brom-2-methylmercapto-4-(1H)-pyrimidinon unter Rückfluß. Nach vollständiger Lösung des Pyrimidions (ca. 60 Minuten) destillierte man bei ca. 200 mm Hg das POCl₃ ab, nahm in Methylenchlorid auf und hydrolysierte, wusch die organische Phase neutral, trocknete diese und destillierte das Reaktionsprodukt (Sdp.: 74–77°C/0,2 mm Hg). Man erhielt 60 g (90%) 5-Brom-4-chlor-2-methylmercapto-pyrimidin, Smp.: 43–44°C.

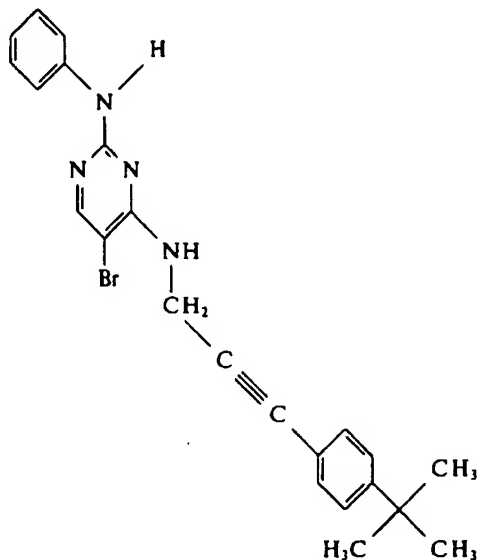
In 100 ml Dimethylformamid wurden 19,2 g 5-Brom-4-chlor-2-methylmercapto-pyrimidin und 9,2 g Propinylaminhydrochlorid vorgelegt und 20,2 g (28 ml) Triethylamin zugetropft. Nach 16 Stunden (DC-Umsatzkontrolle) destillierte man das Lösungsmittel weitestgehend ab, hydrolysierte und nahm in Methylenchlorid auf. Nach Waschen, Trocknen und Einengen der organischen Phase erhielt man nach Reinigung durch Säulenchromatographie, mit Essigester zu Heptan (1 : 1) als Laufmittel, 19,0 g (92%) 5-Brom-2-methylmercapto-4-propinylaminopyrimidin, Smp.: 127–129°C.

Man suspendierte 32 g einer Mischung aus Kaliumperoxomonosulfat, 2 KHSO₅, KHSO₄ und K₂SO₄ in einer Mischung aus jeweils 50 ml Methanol, Wasser und Essigsäure und gab unter Rühren 12,5 g 5-Brom-2-methylmercapto-4-propinylaminopyrimidin hinzu. Nach Abklingen der exothermen Reaktion (ca. 1 Stunde) extrahierte man mit reichlich Methylenchlorid, wusch die organische Phase und erhielt nach Trocknen und Abdestillieren des Lösungsmittels 9,1 g (65%) 5-Brom-2-methylsulfonyl-4-propinylaminopyrimidin, Smp.: 146–148°C.

Zu 0,9 g NaH (80% in Mineralöl) in 100 ml abs. Toluol gab man 4,2 g Formanilid, rührte ca. 1 Stunde, gab dann 7,1 g 5-Brom-2-methylsulfonyl-4-propinylaminopyrimidin hinzu und rührte weitere 16 Stunden. Nach dem Hydrolysieren trennte man die organische Phase ab, extrahierte die wäßrige Phase mit Essigester, trocknete die vereinigten organischen Phasen und destillierte das Lösungsmittel ab. Das erhaltene Produktgemisch trennte man säulenchromatographisch, mit Essigester und Heptan (1 : 1) als Laufmittel. Man erhielt als erste Fraktion 1,0 g (11%) 5-Brom-N-phenyl-4-propinylamino-2-pyrimidinamin, Smp.: 168°C, und als 2. Fraktion 3,7 g (37%) 5-Brom-N-formyl-N-phenyl-4-propinylamino-2-pyrimidinamin, Smp.: 146°C.

Beispiel 4

5-Brom-N-phenyl-4-(3-(4-tert.-butylphenyl)-propinylamino)-2-pyrimidinamin

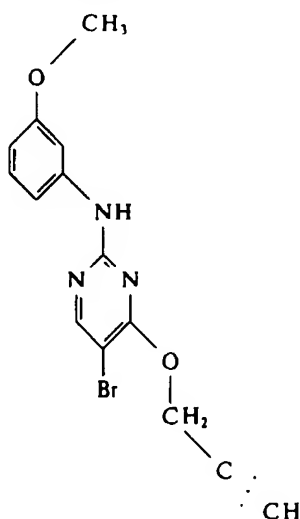


Verbindung Nr. 243

In 30 ml Triethylamin wurden 3,8 g 5-Brom-N-phenyl-4-propinylamino-2-pyrimidinamin, 0,07 g Bis-(triphenylphosphin)-palladiumdichlorid und 0,01 g Kupfer(I)-jodid vorgelegt und 3,9 g 4-tert.-Butyljodbenzol zuge-
 tropft. Nach 16 Stunden wurde die Hauptmenge Triethylamin abdestilliert, der Rückstand in Methylenechlorid
 aufgenommen und mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingeeengt. Nach Reinigung mittels Säulenchromato-
 graphie, Essigester und Heptan (1 : 1) als Laufmittel, erhielt man 2,2 g (40%) 5-Brom-N-phenyl-4-(3-(4-tert.-bu-
 tylphenyl)-propinylamino)-2-pyrimidinamin, Smp.: 167—169°C.

Beispiel 5

5-Brom-2-(3-methoxyanilino)-4-propinyloxypyrimidin



Verbindung Nr. 245

Man suspendierte 246 g einer Mischung aus Kaliumperoxomonosulfat, 2 KHSO₅, KHSO₄ und K₂SO₄ in einer
 Mischung aus jeweils 200 ml Methanol, Wasser und Essigsäure und gab unter Rühren 63,5 g 5-Brom-4-chlor-
 2-methylmercapto-pyrimidin hinzu. Nach Abklingen der exothermen Reaktion (ca. 1 Stunde) extrahierte man

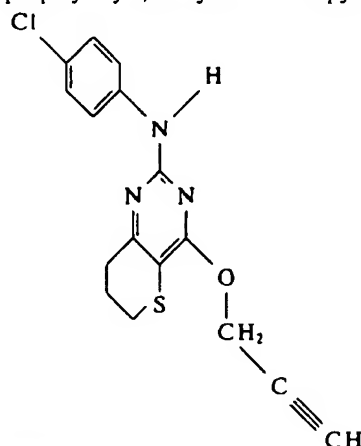
mit reichlich Methylenchlorid, wusch die organische Phase und erhielt nach Trocknung und Abdestillieren des Lösungsmittels 71 g (99%) 5-Brom-4-chlor-2-methylsulfonyl-pyrimidin, Smp.: 105–109°C.

Zu 0,9 g NaH (80% in Mineralöl) in 100 ml abs. Toluol gab man 4,5 g 3-Methoxyformylanilin, rührte ca. 1 Stunde, gab dann 6,1 g 5-Brom-4-chlor-2-methylsulfonyl-pyrimidin dazu und rührte weitere 16 Stunden. Nach dem Hydrolysieren trennte man die organische Phase ab, extrahierte die wäßrige Phase mit Essigester, trocknete die vereinigten organischen Phasen und destillierte das Lösungsmittel ab. Man erhielt 7,6 g (99%) festes 5-Brom-4-chlor-N-formyl-N-phenyl-2-pyrimidinamin, welches ohne weitere Reinigung eingesetzt werden konnte.

Zu 1,1 g NaH (80% in Mineralöl) in 100 ml abs. THF tropfte man 2,1 g Propinylalkohol, rührte eine Stunde und gab dann 6,7 g 5-Brom-4-chlor-N-formyl-N-phenyl-2-pyrimidinamin hinzu. Nach 16 Stunden hydrolysierte man, extrahierte mit Essigester oder Methylenchlorid, wusch die organische Phase, trocknete diese und erhielt nach Abdestillieren des Lösungsmittels und Reinigung durch Säulenchromatographie, mit Essigester und Heptan (1 : 1) als Laufmittel, 3,0 g (46%) 5-Brom-2-(3-methoxyanilino)-4-propinyloxy-pyrimidin, Smp.: 138–140°C.

Beispiel 6

2-(4-Chloranilino)-4-propinyloxy-7,8-dihydro-6H-thiopyrano-[2,3-d]-pyrimidin



Verbindung Nr. 340

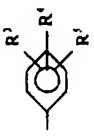













In 200 ml Wasser wurden 15,1 g 2,4,5,6-Tetrahydro-thiopyran-3-on-2-carbonsäureethylester, 18,6 g 4-Chlorphenyl-guanidinnitrat und 8,5 g wasserfreies Natriumcarbonat 4 Tage gerührt. Bei neutralem pH-Wert filtrierte man ab und erhielt 20,0 g (85%) 2-(4-Chloranilino)-1,6,7,8-tetrahydro-thiopyrano-[2,3-d]-pyrimidin-4-on, Smp.: 238–240°C.

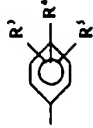














In 100 ml POCl₃ und 3 ml N,N-Dimethylanilin erhitzte man 19,8 g 2-(4-Chloranilino)-1,6,7,8-tetrahydro-thiopyrano-[2,3-d]-pyrimidin-4-on unter Rückfluß. Nach vollständiger Lösung des Pyrimidinons (ca. 60 Minuten) destillierte man bei ca. 200 mm Hg das POCl₃ ab, nahm in Methylenchlorid auf und hydrolysierte, wusch die organische Phase neutral, trocknete und destillierte das Lösungsmittel ab. Nach säulenchromatographischer Trennung, mit Essigester und Heptan (1 : 1) als Laufmittel, erhielt man 4,8 g (23%) 4-Chlor-2-(4-chloranilino)-7,8-dihydro-6H-thiopyrano-[2,3-d]pyrimidin als Öl.

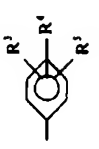













Zu 0,9 g NaH (80% in Mineralöl) in 100 ml abs. THF tropfte man 1,7 g Propinylalkohol, rührte eine Stunde und gab dann 4,8 g 4-Chlor-2-(4-chloranilino)-7,8-dihydro-6H-thiopyrano-[2,3-d]-pyrimidin hinzu. Nach 16 Stunden hydrolysierte man, extrahierte mit Essigester oder Methylenchlorid, wusch die organische Phase, trocknete diese und erhielt nach Abdestillation des Lösungsmittels und Reinigung durch Säulenchromatographie, mit Essigester und Heptan (1 : 1) als Laufmittel, 1,8 g (36%) 2-(4-Chloranilino)-4-propinyloxy-7,8-dihydro-6H-thiopyrano-[2,3-d]-pyrimidin, Smp.: 106–108°C.
















Entsprechend der oben aufgeführten Beispiele können die in den Tabellen 1, 2 und 3 genannten Verbindungen hergestellt werden.















Tabelle I

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ³	R ⁴	R ⁵	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
1	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	0	139-141
2	H	H		H	CH ₃	H	OCH ₃	O	0	
3	H	H		CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	O	0	
4	H	H		H		H	OCH ₃	O	0	
5	H	H		(CH ₃) ₄		H	OCH ₃	O	0	
6	H	H		(CH ₃) ₃		H	OCH ₃	O	0	
7	H	H		H	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	O	0	
8	H	H		H	C ₃ H ₇	H	OCH ₃	O	0	
9	H	H		CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃		H	OCH ₃	O	0	
10	H	H		H	H	CH ₃	OCH ₃	O	0	
11	H	H		H	H	Br	OCH ₃	O	0	
12	H	H		H	H	J	OCH ₃	O	0	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ³	R ⁵	R ⁶	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
13	H	H		H	H	H	OCH ₂ - 	O	0	134-137
14	CH ₂ OCH ₃	H		H	H	H	OCH ₃	O	0	56-58
15	CH ₂ OCH ₃	H		H	CH ₃	H	OCH ₃	O	0	
16	CH ₂ OCH ₃	H		CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	O	0	
17	CH ₂ OCH ₃	H		H	H	CH ₃	OCH ₃	O	0	
18	H	H		H	H	H	OCH ₃	NH	0	
19	H	H		H	CH ₃	H	OCH ₃	NH	0	
20	H	H		CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	NH	0	
21	H	H		H		H	OCH ₃	NH	0	
22	H	H		(CH ₃) ₄		H	OCH ₃	NH	0	
23	H	H		(CH ₃) ₃		H	OCH ₃	NH	0	
24	H	H		H	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	NH	0	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ³	R ¹	R ²	R ³	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [° C])
25	H	H		H	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	NH	0		
26	H	H		CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	NH	0			
27	H	H		H	H	CH ₃	OCH ₃	NH	0		
28	H	H		H	H	Br	OCH ₃	NH	0		
29	H	H		H	H	J	OCH ₃	NH	0		
30	H	H		H	H	H	 OCH ₃	NH	0		
31	CH ₂ OCH ₃	H		H	H	H	OCH ₃	NH	0		
32	CH ₂ OCH ₃	H		H	CH ₃	H	OCH ₃	NH	0		
33	CH ₂ OCH ₃	H		CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	NH	0		
34	CH ₂ OCH ₃	H		H	H	CH ₃	OCH ₃	NH	0		
35	H	H		H	H	H	OC ₂ H ₅	NH	0		
36	H	H		H	CH ₃	H	OC ₂ H ₅	NH	0		

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
37	H	H		CH ₃	CH ₃	H	n-OC ₃ H ₇	NH	0	
38	H	H		H		H	n-OC ₃ H ₇	NH	0	
39	H	H		(CH ₂) ₄		H	OC ₂ H ₅	NH	0	
40	H	H		(CH ₂) ₃		H	OC ₂ H ₅	NH	0	
41	H	H		H	C ₂ H ₅	H	OC ₂ H ₅	NH	0	
42	H	H		H	C ₃ H ₇	H	OC ₂ H ₅	NH	0	
43	H	H		CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₃		H	OC ₂ H ₅	NH	0	
44	H	H		H	H	CH ₃	t-OC ₄ H ₉	NH	0	
45	H	H		H	H	Br	OC ₂ H ₅	NH	0	
46	H	H		H	H	J	OC ₃ H ₇	NH	0	
47	H	H		H	H	H	O(CH ₂) ₂ 	NH	0	
48	CH ₂ OCH ₃	H		H	H	H	t-OC ₄ H ₉	NH	0	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [° C])
49	CH ₂ OCH ₃	H		H	CH ₃	H	H	OC ₂ H ₅	NH	0	
50	CH ₂ OCH ₃	H		CH ₃	CH ₃	H	H	n-OC ₄ H ₉	NH	0	
51	CH ₂ OCH ₃	H		H	H	CH ₃	CH ₃	OC ₂ H ₅	NH	0	
52	H	H		H	H	H	H	OC ₂ H ₅	O	0	
53	H	H		H	CH ₃	H	H	n-OC ₃ H ₇	O	0	
54	H	H		CH ₃	CH ₃	H	H	OC ₂ H ₅	O	0	
55	H	H		H		H	H	OC ₂ H ₅	O	0	
56	H	H		(CH ₂) ₄		H	H	n-OC ₄ H ₉	O	0	
57	H	H		(CH ₂) ₃		H	H	OC ₂ H ₅	O	0	
58	H	H		H	C ₂ H ₅	H	H	i-OC ₃ H ₇	O	0	
59	H	H		H	C ₃ H ₇	H	H	OC ₂ H ₅	O	0	
60	H	H		CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂		H	H	n-OC ₄ H ₉	O	0	

5

10

15

20

25

30

35

40





















45













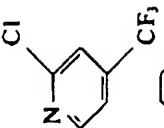



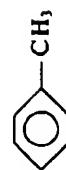




50

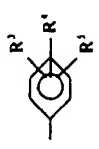



















55

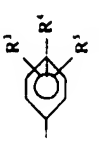












60














65

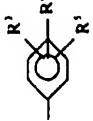





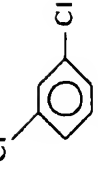

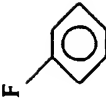

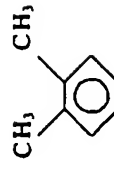
Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ⁷	R ⁶	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
61	H	H		H	H	CH ₃	n-OC ₆ H ₁₃	O	0	
62	H	H		H	H	Br	OC ₂ H ₅	O	0	
63	H	H		H	H	J	OC ₂ H ₅	O	0	
64	H	H		H	H	H		O	0	
65	CH ₃ OCH ₃	H		H	H	H	OC ₂ H ₅	O	0	
66	CH ₃ OCH ₃	H		H	CH ₃	H	i-OC ₆ H ₅	O	0	
67	CH ₃ OCH ₃	H		CH ₃	CH ₃	H	OC ₂ H ₅	O	0	
68	CH ₃ OCH ₃	H		H	H	CH ₃		O	0	
69	H	H		H	H		OCH ₃	O	0	
70	H	H		H	CH ₃		OCH ₃	O	0	
71	H	H		CH ₃	CH ₃		OCH ₃	O	0	
72	H	H		H			OCH ₃	O	0	

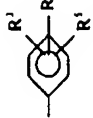
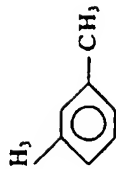
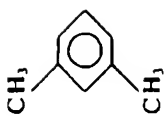
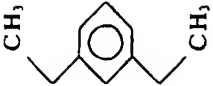
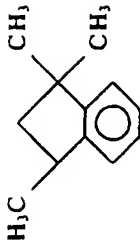
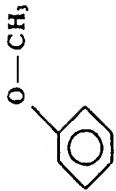
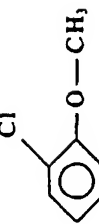
Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ⁷	R ¹	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
73	H	H		(CH ₂) ₄			CH ₃	O	0	
74	H	H		(CH ₂) ₃			OCH ₃	O	0	
75	H	H		H	C ₂ H ₅		OCH ₃	O	0	
76	H	H		H	C ₃ H ₇		OCH ₃	O	0	
77	H	H		CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂			OCH ₃	O	0	
78	H	H		H	H		OCH ₃	O	0	
79	H	H		H	H		OCH ₃	N	0	
80	H	H		H	H		C ₂ H ₅	O	0	
81	H	H		H	H		OCH ₂ CH ₃	O	0	
82	CH ₂ OCH ₃	H		H	H		OCH ₃	O	0	


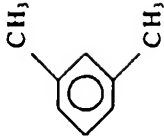
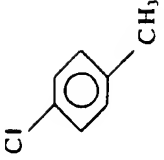
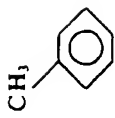
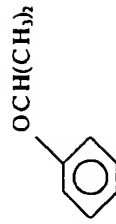
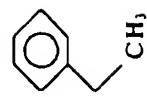
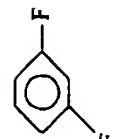
Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
83	CH ₂ OCH ₃	H			H	CH ₃		OCH ₃	O	0	
84	CH ₂ OCH ₃	H			CH ₃	CH ₃		OCH ₃	O	0	
85	CH ₂ OCH ₃	H			H	H		OCH ₃	N	0	
86	H	H		H	H	H	H	Br	O	0	149
87	H	H		H	H	CH ₃	H	Br	O	0	
88	H	H		H	CH ₃	CH ₃	H	Br	O	0	
89	H	H		H	H		H	Br	O	0	
90	H	H		H	(CH ₂) ₄		H	Br	O	0	
91	H	H		H	(CH ₂) ₅		H	Br	O	0	
92	H	H		H	H	C ₂ H ₅	H	Br	O	0	
93	H	H		H	H	C ₃ H ₇	H	Br	O	0	
94	H	H		H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂		H	Br	O	0	

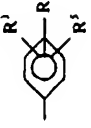
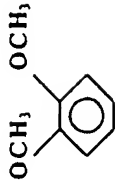

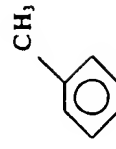
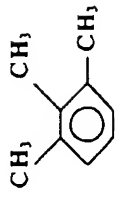


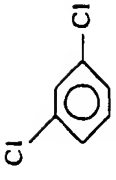

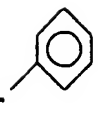

Bsp Nr.	R ¹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
95	H	H		H	H	CH ₃	Br	O	0	
96	H	H		H	H	Br	Br	O	0	
97	H	H		H	H	J	Br	O	0	
98	H	H		H	H	H	J	O	0	
99	CH ₃ OCH ₃	H		H	H	H	Br	O	0	
100	CH ₃ OCH ₃	H		H	CH ₃	H	Br	O	0	
101	CH ₃ OCH ₃	H		CH ₃	CH ₃	H	Br	O	0	
102	CH ₃ OCH ₃	H		H	H	CH ₃	Br	O	0	
103	H	H		H	H	H	CH ₃	O	0	138
104	H	H		H	H	H	CH ₃ CH ₂ CH ₃	O	0	120
105	CH ₃	H		H	H	H	OCH ₃	O	0	
106	CH ₃	H		H	H	H	CH ₃	O	0	


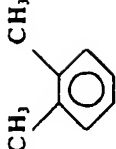
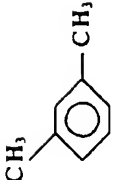
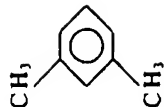
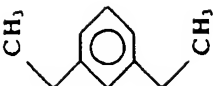
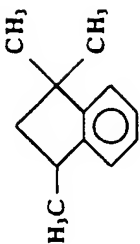
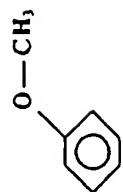
Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁴	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [° C])
107	C ₂ H ₅	H		H	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	0	
108	n-C ₃ H ₇	H		H	H	H	n-C ₄ H ₉	O	0	
109	i-C ₃ H ₇	H		H	H	H	OCH ₃	O	0	
110	CH ₃ - 	H		H	H	H	OC ₂ H ₅	O	0	
111	CH ₃	H		H	H	H	CH ₃	O	0	86
112	CH ₃	H		H	CH ₃	H	CH ₃	O	0	
113	CH ₃	H		H	H	H	Cl	O	0	84
114	CH ₃	H		H	H	H	CH ₂ COOCH ₃	O	0	175-177
115	CH ₃	H		H	H	H	CH ₂ COOCH ₃	O	0	
116	CH ₃	H		H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{C}-\text{OCH}_3 \\ \parallel \\ \text{C}-\text{OCH}_3 \end{array}$	O	0	
117	CH ₃	H		H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{C}-\text{OCH}_3 \\ \parallel \\ \text{C}-\text{OCH}_3 \end{array}$	O	0	


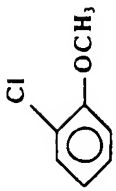
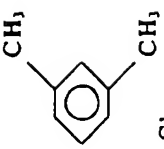
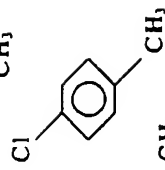
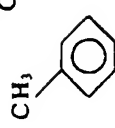
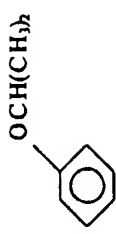
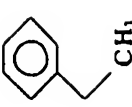

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ³	R ⁴	R ⁵	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
118	CH ₃	H		H	H	H	CH ₃ CONH ₂	O	0	
119	CH ₃	H		H	H	H	CH ₂ CH ₂ CN	O	0	112-113
120	CH ₃	H		H	H	H	CH ₂ CH ₂ COOCH ₃	O	0	
121	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	0	138-140
122	H	H		H	CH ₃	H	OC ₂ H ₅	O	0	
123	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	0	
124	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	0	
125	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	0	
126	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	0	
127	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	0	

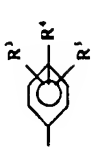
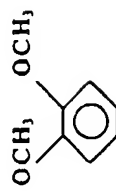
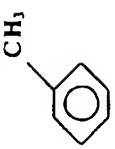
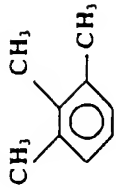







Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ³	R ²	R ¹	R ⁵	R ⁶	X	n	Physical. Konst. (Smp. [° C])
128	H	H		H	H	H	H	OCH ₃	O	O	0	
129	H	H		H	H	H	H	OCH ₃	O	O	0	
130	H	H		H	H	H	H	OCH ₃	O	O	0	
131	H	H		H	H	H	H	OCH ₃	O	O	0	
132	H	H		H	H	H	H	n-OC ₃ H ₇	O	O	0	
133	H	H		H	H	H	H	OC ₂ H ₅	O	O	0	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁵	R ⁷	R ⁶	R ⁸	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [°C])
134	H	H		H	H	H	H	OCH ₃	O	0	
135	H	H		H	H	H	H	OCH ₃	O	0	
136	H	H		H	H	H	H	OCH ₃	O	0	
137	H	H		H	CH ₃	H	H	OCH ₃	O	0	
138	H	H		H	C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	O	0	
139	H	H		H	H	H	CH ₃	Cl	O	0	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [°C])
140	H	H		H	H	H	OC ₂ H ₅ - 	O	0	
141	H	H		CH ₃	CH ₃	J	OCH ₃	O	0	
142	H	H		H	H	H	OC ₂ H ₅	O	0	
143	H	H		H	H	H	Br	O	0	
144	H	H		H	CH ₃	H	Br	O	0	
145	H	H		H	H	H	Br	O	0	
146	H	H		H	H	H	Br	O	0	
147	H	H		H	H	H	Br	O	0	
148	H	H		H	H	H	Br	O	0	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ²	R ⁴	R ³	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
149	H	H		H	H	H	Br	O	0	
150	H	H		H	H	H	Br	O	0	
151	H	H		H	H	H	Br	O	0	
152	H	H		H	H	H	Br	O	0	
153	H	H		H	H	H	Br	O	0	
154	H	H		H	H	H	Br	O	0	138-140

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	n	Physical. Konst. (Smp. °C)
155	H	H		H	H	H	Br	O	0	168-170
156	H	H		H	H	H	Br	O	0	165-166
157	H	H		H	H	H	Br	O	0	124-125
158	H	H		H	H	H	Br	O	0	
159	H	H		H	CH ₃	H	Br	O	0	
160	H	H		H	C ₃ H ₇	H	Br	O	0	
161	H	H		H	H	CH ₃	Br	O	0	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁴	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [° C])
162	H	H		H	H	H	Br	O	0	
163	H	H		CH ₃	CH ₃	J	Br	O	0	
164	H	H		H	H	H	Br	O	0	
165	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	1	134
166	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	2	
167	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	3	
168	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	4	
169	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	5	
170	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	1	
171	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	2	

5

10

15

20

25

30

35

40








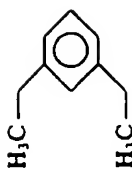
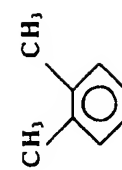
45

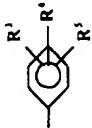







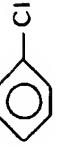



50

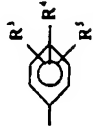
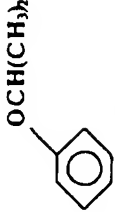

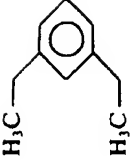
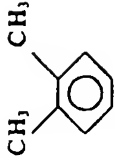






55














60

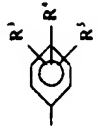


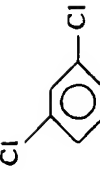

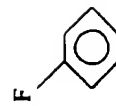
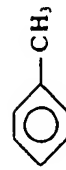
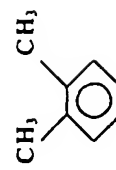
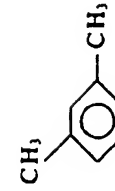
65


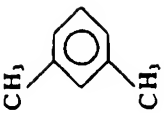
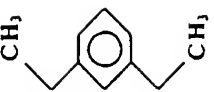
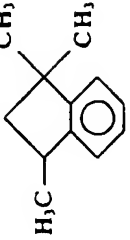
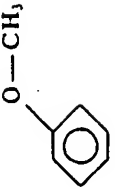
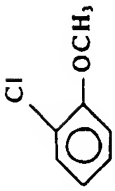
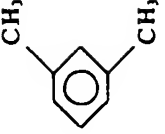

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [° C])
172	H	H		H	H	H	OC ₂ H ₅	O	4	
173	H	H		H	H	H	OC ₂ H ₅	O	1	
174	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	2	
175	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	1	
176	H	H		H	H	H	CH ₃	O	2	
177	H	H		H	H	H	n-C ₃ H ₇	O	3	
178	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	1	
179	H	H		H	H	H	OCH ₃	O	1	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁴	R ⁹	X	n	Physical. Konst. (Smp. °C)
180	H	H		H	H	H	Br	O	1	
181	H	H		H	H	H	Br	O	2	
182	H	H		H	H	H	Br	O	3	
183	H	H		H	H	H	Br	O	4	
184	H	H		H	H	H	Br	O	5	
185	H	H		H	H	H	J	O	1	
186	H	H		H	H	H	Cl	O	2	
187	H	H		H	H	H	Br	O	4	
188	H	H		H	H	H	J	O	1	
189	H	H		H	H	H	Cl	O	2	
190	H	H		H	H	H	Br	O	1	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [°C])
191	H	H		H	H	H	Br	O	2	
192	H	H		H	H	H	Br	O	3	
193	H	H		H	H	H	Br	O	1	
194	H	H		H	H	H	Br	O	1	
195	H	H		H	H	H	Br	NH	0	168
196	H	H		H	H	CH ₃	Br	NH	0	
197	H	H		CH ₃	H	CH ₃	Br	NH	0	
198	H	H		H			Br	NH	0	
199	H	H		(CH ₃) ₄			Br	NH	0	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. (°C))
200	H	H		(CH ₃) ₃			H	Br	NH	0	
201	H	H		H		C ₂ H ₅	H	Br	NH	0	
202	H	H		H		C ₃ H ₇	H	Br	NH	0	
203	H	H		CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃			H	Br	NH	0	
204	H	H		H		H	CH ₃	Br	NH	0	
205	H	H		H		H	Br	Br	NH	0	
206	H	H		H		H	J	Br	NH	0	
207	H	H		H		H	H	J	NH	0	
208	CH ₂ OCH ₃	H		H		H	H	Br	NH	0	
209	CH ₃ OCH ₃	H		H		CH ₃	H	Br	NH	0	
210	CH ₃ OCH ₃	H		CH ₃		CH ₃	H	Br	NH	0	
211	CH ₃ OCH ₃	H		H		H	CH ₃	Br	NH	0	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁶	R ⁵	R ⁴	R ³	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [° C])
212	H	H		H	H	H	H	NH	0	170-172
213	H	H		H	H	H	CH ₃	NH	0	
214	H	H		H	H	H	H	NH	0	
215	H	H		H	H	H	H	NH	0	
216	H	H		H	H	H	H	NH	0	
217	H	H		H	H	H	H	NH	0	
218	H	H		H	H	H	H	NH	0	
219	H	H		H	H	H	H	NH	0	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ³	R ⁴	R ⁵	X	n	Physical. Konst. (Smp. [°C])
220	H	H		H	H	H	OCH ₃	NH	0	
221	H	H		H	H	H	OCH ₃	NH	0	
222	H	H		H	H	H	OCH ₃	NH	0	
223	H	H		H	H	H	OCH ₃	NH	0	
224	H	H		H	H	H	SCH ₃	NH	0	
225	H	H		H	H	H		NH	0	

5

10

15

20

25

30

35

40


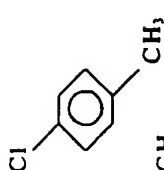
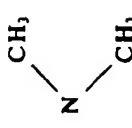
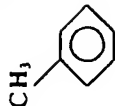

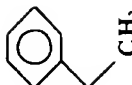
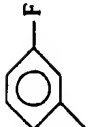
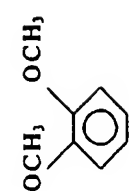
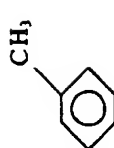
45


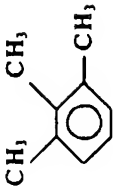



















50





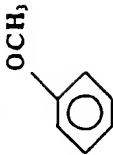






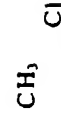

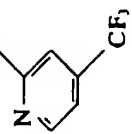


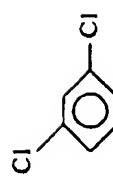
55

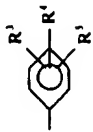

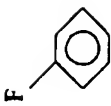

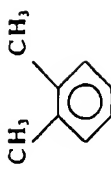
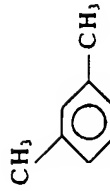
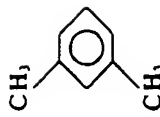
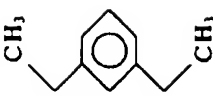
60

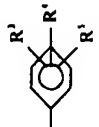
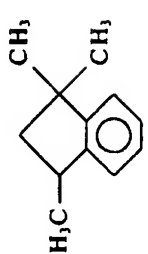
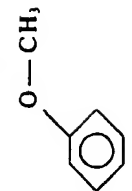
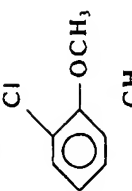
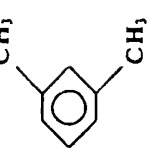
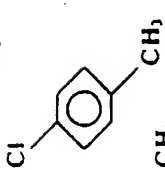
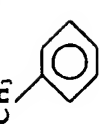
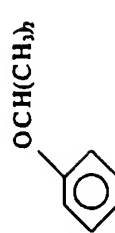
65

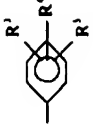
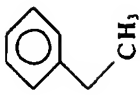
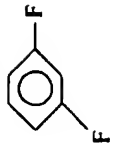
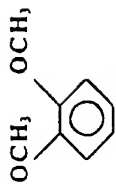
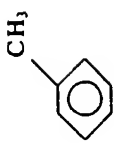
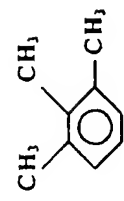




Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ³	R ²	R ¹	Physikal. Konst. (Smp. °C)
226	H	H		H	H	H		NH 0
227	H	H		H	H	H	CH ₃	NH 0
228	H	H		H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	NH 0
229	H	H		H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	NH 0
230	H	H		H	H	CH ₃	OC ₂ H ₅	NH 0
231	H	H		H	H	H	OCH ₃	NH 0
232	H	H		CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	NH 0

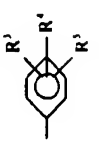













Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [°C])
233	H	H		H	H	H	OCH ₃	H	NH	0		
234	H	H		H	H	H	Br		O	0		
235	H	H		H	CH ₃	CH ₃	Br		O	0		
236	H	H		CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br		O	0		
237	H	H		H		CH ₃	Br	CH ₃	NH	0		
238	H	H		—(CH ₂) ₄ —			Br		NH	0		
239	H	H		—(CH ₂) ₃ —			Br		NH	0		
240	H	H		H	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	CH ₃	NH	0		
241	H	H		H	C ₃ H ₇		Br		NH	0		
242	H	H		CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₃			Br		NH	0		
243	H	H		H	H	H	Br		NH	0		167-169

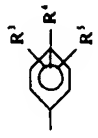












Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [°C])
244	H	H		H	H		Br	NH	0		
245	H	H		H	H		Br	NH	0	138-139	
246	H	H		H	H		Br	NH	0		
247	CH ₃	H		H	H		Br	NH	0		
248	CH ₃	H		H	CH ₃	CH ₃	Br	NH	0		
249	CH ₃	H		CH ₃	CH ₃		Br	NH	0		
250	CH ₃	H		H	H		Br	NH	0		
251	H	H		H	H	H	Br	NH	0		
252	H	H		H	CH ₃	H	Br	NH	0		
253	H	H		H	H	H	Br	NH	0		







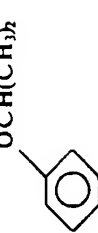

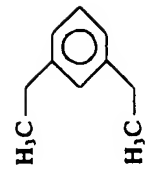
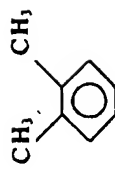
Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ⁷	R ⁶	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [°C])
254	H	H		H	H	H	Br	NH	0	
255	H	H		H	H	H	Br	NH	0	
256	H	H		H	H	H	Br	NH	0	
257	H	H		H	H	H	Br	NH	0	
258	H	H		H	H	H	Br	NH	0	
259	H	H		H	H	H	Br	NH	0	
260	H	H		H	H	H	Br	NH	0	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁴	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
261	H	H		H	H	H	Br	NH	0	
262	H	H		H	H	H	Br	NH	0	117-120
263	H	H		H	H	H	Br	NH	0	174-176
264	H	H		H	H	H	Br	NH	0	
265	H	H		H	H	H	Br	NH	0	130-132
266	H	H		H	H	H	Br	NH	0	
267	H	H		H	CH ₃	H	Br	NH	0	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ⁷	R ³	R ⁵	X	n	Physical. Konst. (Smp. [° C])
268	H	H		H	C ₃ H ₇	H	Br	NH	0	
269	H	H		H	H	CH ₃	Br	NH	0	
270	H	H		H	H	H	Br	NH	0	
271	H	H		CH ₃	CH ₃	J	Br	NH	0	
272	H	H		H	H	H	Br	NH	0	
273	H	CHO		H	H	H	CH ₃	O	0	91
274	H	CHO		H	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	0	71
275	H	CHO		H	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	O	0	
276	H	CHO		H	H	H	OCH ₃	O	0	78-82

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
289	CH ₃ OCH ₃	CHO		H	H	CH ₃	OCH ₃	O	0	
290	H	CHO		H	H	H	Br	O	0	108-109
291	H	CHO		H	CH ₃	H	Br	O	0	
292	H	CHO		H	CH ₃	H	Br	NH	0	146
293	H	CHO		H		H	Br	O	0	
294	H	CHO		(CH ₃) ₄		H	Br	O	0	
295	H	CHO		(CH ₃) ₅		H	Br	O	0	
296	H	CHO		H	C ₂ H ₅	H	Br	O	0	
297	H	CHO		H	C ₃ H ₇	H	Br	O	0	
298	H	CHO		CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₃		H	Br	O	0	
299	H	CHO		H	H	CH ₃	Br	O	0	
300	H	CHO		H	H	Br	Br	O	0	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
301	H	CHO		H	H	J	Br	O	0	
302	H	CHO		H	H	H	Br	N	0	
303	CH ₃	CHO		H	H	H	Br	O	0	
304	CH ₃	CHO		H	CH ₃	H	Br	O	0	
305	CH ₃	CHO		CH ₃	CH ₃	H	Br	O	0	
306	CH ₃	CHO		H	H	CH ₃	Br	O	0	
307	H	CHO		H	H	H	OCH ₃	O	1	
308	H	CHO		H	H	H	OCH ₃	O	2	
309	H	CHO		H	H	H	OCH ₃	O	3	
310	H	CHO		H	H	H	OCH ₃	O	4	
311	H	CHO		H	H	H	OCH ₃	O	5	
312	H	CHO		H	H	H	OC ₂ H ₅	O	1	

Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁴	R ³	R ¹	R ²	R ³	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
313	H	CHO		H	H	H	CHO	OC ₂ H ₅	O	2	
314	H	CHO		H	H	H	CHO	OC ₂ H ₅	O	4	
315	H	CHO		H	H	H	CHO	OCH ₃	O	1	
316	H	CHO		H	H	H	CHO	OCH ₃	O	2	
317	H	CHO		H	H	H	CHO	Br	O	1	
318	H	CHO		H	H	H	CHO	Br	O	2	
319	H	CHO		H	H	H	CHO	Br	O	3	
320	H	CHO		H	H	H	CHO	Cl	O	1	
321	H	CHO		H	H	H	CHO	Cl	O	1	













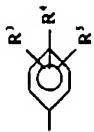













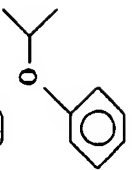










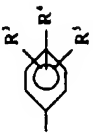











Bsp. Nr.	R ¹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁴	R ³	X	d	Physikal. Konstl. (Smp. [° C])
322	CH ₃	CHO		H	H	H	CH ₃	O	0	101-102
323	CH ₃	CHO		H	H	H	CH ₃	NH	0	
324	CH ₃	CHO		H	H	CH ₃	CH ₃	O	0	
325	CH ₃	CH ₃		H	CH ₃	H	CH ₃	O	0	
326	n-C ₃ H ₇	CH ₃		H	H	H	CH ₃	NH	0	
327	 CH ₂	CH ₃		H	H	H	H	O	0	
328	CH ₃	CH ₃		H	H	H	H	S	0	
329	C ₂ H ₅	CHO		H	CH ₃	H	H	NH	0	
330	H	CH ₃		H	H	H	H	S	0	
331	H	CH ₃		H	H	H	H	S	0	

Tabelle 2

Bsp. Nr.	R ¹ /R ²	R ¹		R ⁴	R ³	R ²	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
332	(CH ₂) ₆	H		H	H	H	O	0	128
333	(CH ₂) ₅	H		H	H	H	O	0	
334	(CH ₂) ₅	H		H	CH ₃	H	O	0	
335	(CH ₂) ₄	H		H	H	H	O	0	
336	(CH ₂) ₄	H		H	H	H	O	1	
337	CH ₂ SCH ₂	H		H	H	H	O	0	
338	CH ₂ SCH ₂	H		H	H	H	O	1	
339	CH ₂ OCH ₂	H		H	H	H	O	0	
340	(CH ₂) ₅ S	H		H	H	H	O	0	106-108
341	(CH ₂) ₅ S	H		H	CH ₃	H	O	0	
342	(CH ₂) ₅ S	H		H	H	H	O	0	

Bsp. Nr.	R ¹ /R ⁹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [° C])
343	S(CH ₂) ₃	H		H	H	H	O	0	
344	(CH ₂) ₂ O	H		H	H	H	O	0	
345		H		H	H	H	O	0	153-155
346	(CH ₂) ₃	H		H	H	H	NH	0	
347	(CH ₂) ₃	H		H	CH ₃	H	NH	0	
348	(CH ₂) ₄	H		H	H	H	NH	0	
349	(CH ₂) ₄	H		H	H	H	NH	1	
350	CH ₃ SCH ₂	H		H	H	H	NH	0	
351	CH ₃ SCH ₂	H		H	H	H	NH	1	
352	CH ₃ OCH ₂	H		H	H	H	NH	0	
353	(CH ₂) ₅ S	H		H	H	H	NH	0	

Bsp. Nr.	R ¹ /R ²	R ²		R ⁴	R ⁷	R ⁴	X	n	Physical. Konst. (Smp. °C)
354	(CH ₂) ₃ S	H		H	CH ₃	H	NH	0	
355	(CH ₂) ₃ S	H		H	H	H	NH	0	
356	S(CH ₂) ₃	H		H	H	H	NH	0	
357	(CH ₂) ₃ O	H		H	H	H	NH	0	
358	(CH ₂) ₃	H		H	H	H	S	0	
359	(CH ₂) ₃	H		H	H	H	S	0	
360	(CH ₂) ₃	CHO		H	H	H	NH	0	134
361	(CH ₂) ₃	CH ₃		H	H	H	NH	0	
362	(CH ₂) ₃	CHO		H	CH ₃	H	O	0	
363	(CH ₂) ₄	CHO		H	H	H	O	0	
364	(CH ₂) ₄	CHO		H	H	H	O	1	

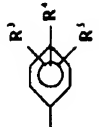





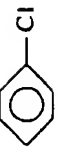

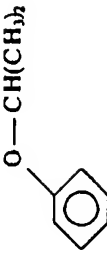

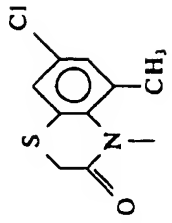
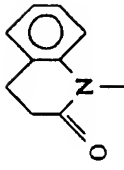
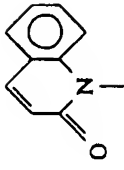
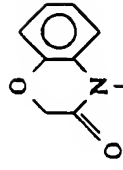
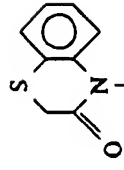

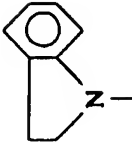
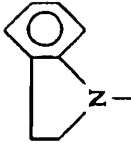
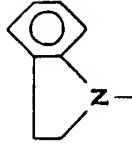

Bsp. Nr.	R ¹ /R ⁹	R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
365	CH ₂ SCH ₂	C ₂ H ₅		H	H	H	O	0	
366	CH ₂ SCH ₂	CH ₃		H	H	H	O	1	
367	CH ₂ OCH ₂	CHO		H	H	H	NH	0	
368	(CH ₂) ₂ S	CH ₃		H	H	H	NH	0	
369	(CH ₂) ₂ S	CH ₃		H	CH ₃	H	O	0	
370	(CH ₂) ₂ S	CH ₃		H	H	H	NH	0	
371	S(CH ₂) ₂	CH ₃		H	H	H	NH	0	
372	(CH ₂) ₂ O	CHO		H	H	H	NH	0	

Tabelle 3

Bsp. Nr.	R ¹ /R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [° C])
373	H		H	H	H	OCH ₃	O	0	
374	CH ₃		H	H	H	Br	O	0	
375	H		H	H	H	Br	NH	0	
376	CH ₃ OCH ₂		H	H	H	OCH ₃	O	0	
377	C ₃ H ₇		H	H	H	OCH ₃	O	0	

Bsp. Nr.	R ¹ /R ²	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. [° C])
378	H	H	H	H	OCH ₃	O	0	
379	H	H	H	H	OC ₂ H ₅	NH	0	
380	H	H	H	H	Br	O	0	
381	H	H	H	H	OC ₂ H ₅	O	0	
382	H	H	H	H	OCH ₃	O	0	

Bsp. Nr.	R ¹ /R ²		R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	X	n	Physikal. Konst. (Smp. °C)
383	H		H	H	H	OCH ₃	O	0	139
384	H		H	H	H	OCH ₃	O	1	109
385	H		H	H	CH ₂ -N- 	OCH ₃	O	0	107-109

C. Biologische Beispiele

Beispiel 1

Weizenpflanzen der Sorte "Diplomat" wurden ca. 4 Wochen nach Aussaat mit wäßrigen Suspensionen der erfindungsgemäßen Verbindungen tropfnaß behandelt.

Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von *Pseudocercospora herpotrichoides* inokuliert. Die Pflanzen wurden danach bei 16 bis 18°C und ca. 90 bis 100% rel. Luftfeuchte gehalten.

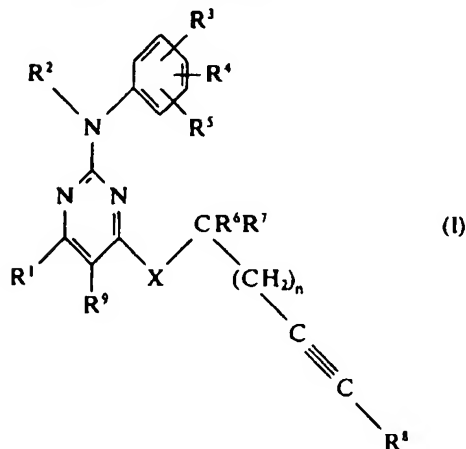
Nach einer Inkubationszeit von ca. 4 Wochen konnte die Befallsauswertung der Versuchspflanzen vorgenommen werden. Der Wirkungsgrad wurde aus dem Befallsgrad im Vergleich zu den unbehandelten, infizierten Kontrollpflanzen ermittelt und ist in Tabelle 4 wiedergegeben.

Tabelle 4

Verbindungen gem. Beispiel	Wirkungsgrad gegenüber <i>Pseudocercospora</i> <i>herpotrichoides</i> in % bei ppm Wirkstoff		
	250	125	60
1	100	100	100
14	100	100	100
86	100	100	100
103	100	100	95
104	100	97	—
111	100	100	80
113	100	96	85
165	100	100	100
195	100	100	100
273	100	100	98
274	100	100	100
276	100	100	100
286	100	100	—
290	100	100	100
292	100	100	80
303	100	100	—
322	100	100	97
332	100	95	—
unbehandelte, infizierte Pflanzen		0	

Patentansprüche

1. Verbindungen der Formel I



worin

R¹ = Wasserstoff, Halogen, (C₁–C₄)-Alkyl, Hydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, Cyano-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy, (C₁–C₄)-Alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-al-

koxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)-alkylthio, Halo-(C₁-C₄)-alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkinyk, (C₁-C₄)-Alkylamino, (C₁-C₄)-Dialkylamino, (C₃-C₉)-Cycloalkylamino, (C₁-C₄)-Alkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylaminocarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy carbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy carbonyl, (C₁-C₄)-Alkylthiocarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylthiocarbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy carbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylloxycarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylamino-(C₁-C₄)-alkyl, Phenoxyphenyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann, und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann, R¹ und R⁹ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten oder aromatischen Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N, S, Si oder P mit 4 bis 10 Ringgliedern, R² = Wasserstoff, Formyl, (C₁-C₄)-Alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, Cyano-(C₁-C₄)-alkyl, Halo-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, Halo-(C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)-alkylthio, Halo-(C₁-C₄)-alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkinyl, (C₁-C₄)-Alkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁-C₄)-Alkoxy carbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylaminocarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy carbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy carbonyl, (C₁-C₄)-Alkylthiocarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylthiocarbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl-(C₁-C₄)-Haloalkylaminocarbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylloxycarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylamino-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxyphenyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann, und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann, R³, R⁴, R⁵ = unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Cyano, Thiocyano, (C₁-C₄)-Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylamino, (C₁-C₄)-Dialkylamino, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, Halo-(C₁-C₄)-alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, Halo-(C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)-alkylthio, Halo-(C₁-C₄)-alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkinyl, (C₁-C₄)-Alkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁-C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁-C₄)-Alkoxy carbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylaminocarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₁-C₄)-Alkoxy carbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy carbonyl, (C₁-C₄)-Alkylthiocarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylthiocarbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)-Haloalkylaminocarbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylloxycarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylamino-(C₁-C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxyphenyl-(C₁-C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₁-C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann, R³, R⁴ und/oder R⁵ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten oder aromatischen Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N, S, Si oder P oder mit 4 bis 10 Ringgliedern, R² und R³ und/oder R⁴ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N, S, Si oder P mit 4 bis 10 Ringgliedern, R⁶, R⁷ = unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₉)-Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)-alkyl, Halo-(C₁-C₄)-alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, Halo-(C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, Halo-(C₁-C₄)-alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkinyl, (C₁-C₄)-Alkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-Dialkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkylamino-(C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl, (C₃-C₉)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl,

(C₃–C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁–C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁–C₄)-Alkyl substituiert sein können, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylamino-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxyphenyl-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituierter 5- oder 6gliedriger Heteroaromat, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil (Heteroaromat) bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁–C₄)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy, (C₁–C₄)-Alkylthio, (C₁–C₄)-Haloalkyl, (C₁–C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R⁶ und R⁷ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten oder teilweise ungesättigten Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N, S, Si oder P mit 4 bis 10 Ringgliedern bilden,

R⁸ = Wasserstoff, Halogen, (C₁–C₄)-Alkyl, Hydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, Cyano-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁–C₄)-alkylthio, Halo-(C₁–C₄)-alkylthio-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylthio-(C₁–C₄)-alkyl, (C₂–C₆)-Alkenyl, (C₂–C₆)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Dialkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, wobei ein C-Atom gegebenenfalls durch die Heteroatome O oder N substituiert sein kann, (C₃–C₉)-Cycloalkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁–C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁–C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁–C₄)-Alkoxy-carbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylaminocarbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Dialkylaminocarbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₁–C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkoxy-carbonyl, (C₁–C₄)-Alkylthiocarbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkylthiocarbonyl, Aminocarbonyl, (C₁–C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkylaminocarbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyloxy-carbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes 5- oder 6gliedriger Heteroaromat, gegebenenfalls substituiertes Phenylamino-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxyphenyl-(C₁–C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil (Heteroaromat) bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁–C₄)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy, (C₁–C₄)-Alkylthio, (C₁–C₄)-Haloalkyl, (C₁–C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R⁹ = Halogen, (C₁–C₄)-Alkyl, (C₁–C₉)-Alkoxy, Hydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, Cyano-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁–C₄)-alkylthio, Halo-(C₁–C₄)-alkylthio-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylthio-(C₁–C₄)-alkyl, (C₂–C₆)-Alkenyl, (C₂–C₆)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkylamino, (C₁–C₄)-Dialkylamino, (C₃–C₉)-Cycloalkylamino, (C₁–C₄)-Alkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Dialkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁–C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁–C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁–C₄)-Alkoxy-carbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylaminocarbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Dialkylaminocarbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkylcarbonyl, (C₁–C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkoxy-carbonyl, (C₁–C₄)-Alkylthiocarbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkylthiocarbonyl, Aminocarbonyl, (C₁–C₄)-Alkylaminocarbonyl, (C₁–C₄)-Haloalkylaminocarbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylmercapto-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyloxy-carbonyl-(C₁–C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxyphenyl-(C₁–C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Säureester, Ester, (C₁–C₄)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy, (C₁–C₄)-Alkylthio, (C₁–C₄)-Haloalkyl, (C₁–C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R¹ und R⁹ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten oder aromatischen Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N, S, Si oder P mit 4 bis 10 Ringgliedern bilden,

X = O, S, NH oder N-(C₁–C₄)-Alkyl und

n = eine Zahl von 0 bis 8 bedeuten, sowie deren Säureadditionssalze.

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, worin

R¹ = Wasserstoff, Halogen, (C₁–C₄)-Alkyl, Hydroxy-(C₁–C₄)-alkyl, Perhalo-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, Halo-(C₁–C₄)-alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylthio, (C₁–C₄)-Alkylthio-(C₁–C₄)-alkyl, (C₂–C₆)-Alkenyl, (C₂–C₆)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkylamino, (C₁–C₄)-Dialkylamino, (C₃–C₉)-Cycloalkylamino, (C₁–C₄)-Alkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Dialkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁–C₄)-Alkoxy-carbonyl, (C₃–C₉)-Cycloalkylamino-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkyl, (C₃–C₉)-Cycloalkyl-(C₁–C₄)-alkyl, (C₃–C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁–C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁–C₄)-Alkyl substituiert sein können, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, Phenoxyphenyl-(C₁–C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁–C₄)-Alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy, (C₁–C₄)-Alkylthio, (C₁–C₄)-Haloalkyl, (C₁–C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann, und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R² = Wasserstoff, Formyl, (C₁–C₄)-Alkyl, Cyano-(C₁–C₄)-alkyl, (C₁–C₄)-Alkoxy-(C₁–C₄)-alkyl,

(C₁—C₄)-Alkylthio, Perhalo-(C₁—C₄)-alkylthio, (C₁—C₄)-Alkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Dialkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Cycloalkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁—C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁—C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁—C₄)-Alkoxy-carbonyl-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁—C₄)-Alkoxy-carbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁—C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁—C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁—C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁—C₄)-Alkyl, (C₁—C₄)-Alkoxy, (C₁—C₄)-Alkylthio, (C₁—C₄)-Haloalkyl, (C₁—C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann, und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R³, R⁴, R⁵ = unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Cyano, Thiocyno, (C₁—C₄)-Alkyl, Cyano-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Alkoxy, (C₁—C₄)-Alkylamino, (C₁—C₄)-Dialkylamino, Halo-(C₁—C₄)-alkyl, Hydroxy-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Alkoxy-(C₁—C₄)-alkyl, Halo-(C₁—C₄)-alkoxy-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁—C₄)-alkylthio, (C₂—C₆)-Alkenyl, (C₂—C₆)-Alkynyl, (C₁—C₄)-Alkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Dialkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Cycloalkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁—C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁—C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁—C₄)-Alkoxy-carbonyl-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Alkylaminocarbonyl-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁—C₄)-Alkoxy-carbonyl, Amino-carbonyl, (C₁—C₄)-Alkylaminocarbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁—C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁—C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylketo-(C₁—C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁—C₄)-Alkyl, (C₁—C₄)-Alkoxy, (C₁—C₄)-Alkylthio, (C₁—C₄)-Haloalkyl, (C₁—C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann, und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R³, R⁴ und/oder R⁵ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten oder aromatischen Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N oder S mit 4 bis 10 Ringgliedern,

R² und R³ und/oder R⁴ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N oder S mit 4 bis 10 Ringgliedern,

R⁵, R⁷ = unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁—C₉)-Alkyl, durch Halogen, (C₁—C₄)-Alkyl oder (C₁—C₄)-Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenyl,

R⁶ und R⁷ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten oder teilweise ungesättigten Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N oder S mit 4 bis 10 Ringgliedern,

R⁸ = Wasserstoff, Halogen, (C₁—C₄)-Alkyl, Hydroxy-(C₁—C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Alkylthio, Perhalo-(C₁—C₄)-alkylthio, (C₂—C₆)-Alkenyl, (C₂—C₆)-Alkynyl, (C₁—C₄)-Alkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Dialkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Cycloalkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, wobei ein C-Atom gegebenenfalls durch die Heteroatome O oder N substituiert sein kann, (C₃—C₉)-Cycloalkyl, (C₃—C₉)-Cycloalkyl-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁—C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁—C₄)-Alkyl substituiert sein können, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁—C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁—C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil (Heteroaromat) bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁—C₄)-Alkyl, (C₁—C₄)-Alkoxy, (C₁—C₄)-Alkylthio, (C₁—C₄)-Haloalkyl, (C₁—C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann, und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R⁹ = Halogen, (C₁—C₄)-Alkyl, (C₁—C₉)-Alkoxy, Hydroxy-(C₁—C₄)-alkyl, Dihydroxy-(C₁—C₄)-alkyl, Cyano-(C₁—C₄)-alkyl, Halo-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Alkoxy-(C₁—C₄)-alkyl, Halo-(C₁—C₄)-alkoxy-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Alkylthio, Halo-(C₁—C₄)-alkylthio, Halo-(C₁—C₄)-alkylthio-(C₁—C₄)-alkyl, (C₂—C₆)-Alkenyl, (C₂—C₆)-Alkynyl, (C₁—C₄)-Alkylamino, (C₁—C₄)-Dialkylamino, (C₃—C₉)-Cycloalkylamino, (C₁—C₄)-Alkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₁—C₄)-Dialkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Cycloalkylamino-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Cycloalkyl, (C₃—C₉)-Cycloalkyl-(C₁—C₄)-alkyl, (C₃—C₉)-Heterocycloalkyl-(C₁—C₄)-alkyl, wobei die cyclischen Reste bis zu dreifach durch (C₁—C₄)-Alkyl substituiert sein können, (C₁—C₄)-Alkylcarbonyl, (C₁—C₄)-Alkoxy-carbonyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl-(C₁—C₄)-alkyl, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenoxy-(C₁—C₄)-alkyl, wobei unter gegebenenfalls substituiert zu verstehen ist, daß der Phenylteil bis zu dreifach durch Halogen, Ester, (C₁—C₄)-Alkyl, (C₁—C₄)-Alkoxy, (C₁—C₄)-Alkylthio, (C₁—C₄)-Haloalkyl, (C₁—C₄)-Haloalkoxy oder einfach durch Nitro oder Cyano substituiert sein kann, und Halo in den Substituenten ein- oder mehrfach durch Halogenatome substituiert bedeuten kann,

R¹ und R⁹ gegebenenfalls zusammen einen gesättigten, teilweise ungesättigten oder aromatischen Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N oder S mit 4 bis 10 Ringgliedern,

X = O oder NH und

n = eine Zahl von 0 bis 4 bedeuten, sowie deren Säureadditionssalze.

3. Verbindung der Formel I gemäß den Ansprüchen 1 oder 2, worin

R¹ = Wasserstoff, (C₁—C₄)-Alkyl oder (C₁—C₄)-Alkoxy-(C₁—C₄)-alkyl,

R² = Wasserstoff, (C₁—C₄)-Alkyl oder Formyl,

R³, R⁴, R⁵ = unabhängig voneinander Wasserstoff, Chlor, Brom, (C₁—C₄)-Alkyl oder (C₁—C₄)-Alkoxy,

R² und R³ gegebenenfalls zusammen einen Teil eines gesättigten, teilweise ungesättigten Carbocyclus oder Heterocyclus mit den Heteroatomen O, N oder S mit 5 oder 6 Ringgliedern,

R⁶, R⁷ = unabhängig voneinander Wasserstoff oder (C₁—C₄)-Alkyl,

R^6 und R^7 gegebenenfalls zusammen einen Teil eines gesättigten, teilweise ungesättigten Carbocyclus mit den Heteroatomen O, N oder S mit 5 oder 6 Ringgliedern,

R^8 = Wasserstoff, Jod, (C_1-C_4) -Alkyl, Di- (C_1-C_4) -alkylamino- (C_1-C_4) -alkyl, (C_3-C_7) -Cycloalkylamino- (C_1-C_4) -alkyl, oder durch Haogen, (C_1-C_4) -Alkyl oder (C_1-C_4) -Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes Phenyl,

R^9 = Halogen, (C_1-C_4) -Alkyl, (C_1-C_4) -Alkoxy, Phenyl- (C_1-C_4) -alkoxy, Cyano- (C_1-C_4) -alkyl oder (C_1-C_4) -Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) -alkyl,

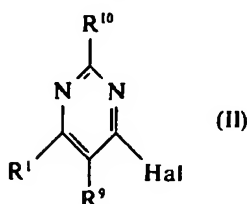
R^1 und R^9 gegebenenfalls zusammen einen Teil eines gesättigten oder ungesättigten Carbocyclus mit 5 oder 6 Ringgliedern, bei dem ein Kohlenstoff durch S substituiert sein kann,

X = O oder NH und

n = 0 oder 1 bedeuten.

4. Verbindungen der Formel I gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 3, worin R^1 = Wasserstoff, R^2 = Wasserstoff oder CHO, R^3 , R^4 , R^5 = unabhängig voneinander Wasserstoff, F, Cl oder OCH_3 , R^6 und R^7 = Wasserstoff, R^8 = Wasserstoff und R^9 = Br oder OCH_3 , X = Sauerstoff oder Stickstoff und n = 0 oder 1 bedeuten.

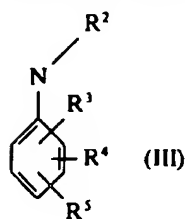
5. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel II



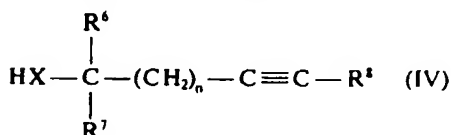
worin

Hal = Cl oder Br und

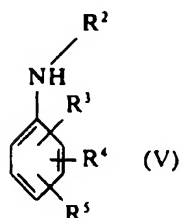
R^{10} = (C_1-C_4) -Alkylthio, im Phenylteil durch Halogen, (C_1-C_4) -Alkyl oder (C_1-C_4) -Alkoxy gegeben, falls substituiertes Phenyl- (C_1-C_4) -alkylthio, S oder den Rest III



bedeuten, mit Verbindungen der Formel IV



umsetzt und, falls R^{10} eine von der Formel III abweichende Bedeutung hat, anschließend die erhaltenen Verbindungen im Rest R^{10} oxidiert und die entstandenen Oxidationsprodukte mit Verbindungen der Formel V



zu den Endprodukten der Formel I mit R^{10} = Rest der Formel III umgesetzt sowie gegebenenfalls, wenn R^8 = H, den Wasserstoff gegen Halogene austauscht.

6. Fungizide Mittel, dadurch gekennzeichnet, daß sie eine wirksame Menge einer Verbindung der Formel I gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 enthalten.

7. Verwendung von Verbindungen der Formel I gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 zur Bekämpfung von Schadpilzen.

8. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man auf diese oder die von ihnen befallenen Pflanzen, Flächen oder Substrate eine wirksame Menge einer Verbindung der Formel I gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 appliziert.

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65